

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2004 年 4 月 22 日 (22.04.2004)

PCT

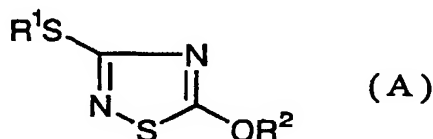
(10) 国際公開番号
WO 2004/033452 A1

- (51) 国際特許分類: C07D 417/12, A01N 43/836
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2003/012831
- (22) 国際出願日: 2003 年 10 月 7 日 (07.10.2003)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願 2002-298489
2002 年 10 月 11 日 (11.10.2002) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 住友化学工業株式会社 (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED) [JP/JP]; 〒541-8550 大阪府 大阪市 中央区 北浜四丁目 5 番 3 3 号 Osaka (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 井原 秀樹 (IHARA, Hideki) [JP/JP]; 〒560-0021 大阪府 豊中市 本町 8-7-2 O Osaka (JP).
- (74) 代理人: 榎本 雅之, 外 (ENOMOTO, Masayuki et al.); 〒541-8550 大阪府 大阪市 中央区 北浜四丁目 5 番 3 3 号 住友化学知的財産センター株式会社内 Osaka (JP).
- (81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

[続葉有]

(54) Title: THIADIAZOLE COMPOUND AND USE THEREOF

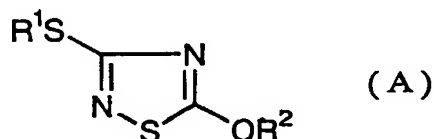
(54) 発明の名称: チアジアゾール化合物及びその用途



(57) Abstract: A thiadiazole compound represented by the formula (A): (A) wherein R¹ represents C₁₋₇ alkyl, C₃₋₇ alkenyl, C₃₋₇ alkynyl, etc.; and R² represents C₁₋₄ alkyl substituted by an optionally substituted heterocyclic group (provided that the heterocycle is a five-membered ring containing one or more oxygen or sulfur atoms as the only heteroatom(s)). The compound is highly active in controlling harmful arthropods.

(57) 要約:

式 (A)



[式中、R¹はC1-C7アルキル基、C3-C7アルケニル基、C3-C7アルキニル基等を表し、R²は置換されていてもよい複素環基で置換されたC1-C4アルキル基（但し、該複素環は異項原子として酸素原子または硫黄原子のみを有す5員の環である。）を表す。]

で示されるチアジアゾール化合物は、有害節足動物に対する優れた防除活性を有する。



(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 *PCT* ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

明 細 書

チアジアゾール化合物及びその用途

技術分野

5 本発明は、チアジアゾール化合物及びその用途に関する。

背景技術

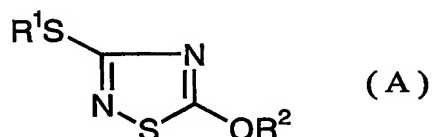
ある種のチアジアゾール化合物が有害節足動物防除剤の有効成分として使用できることが知られている（DE 3 0 3 0 6 6 1 公報）。

10 しかしながら、このチアジアゾール化合物の有害節足動物防除活性は十分では無い場合があり、新たな有害節足動物防除活性を有する化合物が求められている。

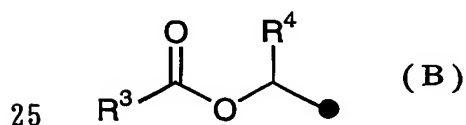
発明の開示

本発明者は鋭意検討した結果、下記式（A）で示されるチアジアゾール化合物
15 において、優れた有害節足動物防除活性を見出し、本発明を完成した。

すなわち、本発明は式（A）



[式中、R¹はC 1－C 7アルキル基、C 3－C 7アルケニル基、C 3－C 7アル
キニル基、C 2－C 7アルコキシアルキル基、C 2－C 7アルキルチオアルキル
20 基、C 4－C 7アルコキシアルコキシアルキル基、C 4－C 7アルキルチオアル
コキシアルキル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフ
ェニル基で置換されたC 1－C 2アルキル基、置換されていてもよいフェニルオ
キシ基で置換されたC 1－C 2アルキル基、置換されていてもよいフェニル基で
置換されたC 2－C 3アルコキシアルキル基、又は式（B）



25

{式中、 R^3 はC 1 - C 3 アルキル基を表し、 R^4 は水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基又は置換されていてもよいフェニル基を表す。} を表し、

R^2 は置換されていてもよい複素環基（但し、該複素環は異項原子として酸素原子または硫黄原子のみを有す5員の環。）で置換されたC 1 - C 4 アルキル基を表す

5 .]

で示されるチアジアゾール化合物（以下、本発明化合物と記す。）、本発明化合物を有効成分として含有する有害節足動物防除剤、及び、本発明化合物の有効量を有害節足動物又は有害節足動物の生息場所に施用する有害節足動物の防除方法を提供する。

10

本発明化合物において、 R^1 または R^2 で示される各置換基としては、下記に示す置換基が具体的に例示される。

R^1 で示される、C 1 - C 7 アルキル基としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、*sec*-ブチル基及び *tert*-ブチル基が挙げられる。

15

R^1 で示される、C 3 - C 7 アルケニル基としては、例えばアリル基、2-ブテニル基、3-メチル-2-ブテニル基及び2-ペンテニル基が挙げられる。

R^1 で示されるC 3 - C 7 アルキニル基としては、例えば2-プロピニル基、1-メチル-2-プロピニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基及び2-ペンチニル基が挙げられる。

20

R^1 で示される、C 2 - C 7 アルコキシアルキル基としては、例えば（C 1 - C 6 アルコキシ）メチル基が挙げられ、具体的には例えばメトキシメチル基、エトキシメチル基、プロポキシメチル基及びイソプロポキシメチル基が挙げられる。

R^1 で示される、C 2 - C 7 アルキルチオアルキル基としては、例えば（C 1 - C 6 アルキルチオ）アルキル基が挙げられ、具体的には例えばメチルチオメチル基、エチルチオメチル基、プロピルチオメチル基及びイソプロピルチオメチル基が挙げられる。

25

R^1 で示される、C 4 - C 7 アルコキシアルコキシアルキル基としては、例えばメトキシエトキシメチル基が挙げられる。

R¹ で示される、C 4－C 7アルキルチオアルコキシアルキル基としては、例えばエチルチオエトキシメチル基が挙げられる。

R¹ で示される、置換されていてもよいフェニル基としては、例えばC 1－C 4アルキル基（メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、tert-
5 プチル基等）、C 1－C 4ハロアルキル基（トリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基等）、C 1－C 4アルコキシ基（メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ等）、C 1－C 4アルキルチオ基（メチルチオ基、エチルチオ基等）、C 1－C 2ハロアルコキシ基（トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基等）、ニトロ基、シアノ基及びハロゲン原子（フッ素
10 原子、塩素原子、臭素原子等）からなる群より選ばれる一種以上で置換されていてもよいフェニル基が挙げられ、具体的には例えばフェニル基、2－メチルフェニル基、3－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、2－トリフルオロメチルフェニル基、3－トリフルオロメチルフェニル基、4－トリフルオロメチルフェニル基、2－メトキシフェニル基、3－メトキシフェニル基、4－メトキシフェニル基、2－メチルチオフェニル基、3－メチルチオフェニル基、4－メチルチオフェニル基、2－トリフルオロメトキシフェニル基、3－トリフルオロメトキシフェニル基、4－トリフルオロメトキシフェニル基、2－ニトロフェニル基、3－ニトロフェニル基、4－ニトロフェニル基、2－シアノフェニル基、3－シアノフェニル基、4－シアノフェニル基、2－フルオロフェニル基、3－フルオロフェニル基、4－フルオロフェニル基、3，4－ジフルオロフェニル基、3，
20 5－ジフルオロフェニル基、2，6－ジフルオロフェニル基、2，4－ジフルオロフェニル基、2－クロロフェニル基、3－クロロフェニル基、4－クロロフェニル基、3，4－ジクロロフェニル基、3，5－ジクロロフェニル基、2，6－ジクロロフェニル基、2，4－ジクロロフェニル基、2－ブロモフェニル基、3－ブロモフェニル基、4－ブロモフェニル基、3，4－ジブロモフェニル基、3，
25 5－ジブロモフェニル基、2，6－ジブロモフェニル基及び2，4－ジブロモフェニル基が挙げられる。

R¹ で示される、置換されていてもよいフェニル基で置換されたC 1－C 2アルキル基としては、例えばC 1－C 4アルキル基（メチル基、エチル基、プロピ

- ル基、イソプロピル基、tert-ブチル基等)、C1-C4ハロアルキル基(トリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基等)、C1-C4アルコキシ基(メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ等)、
- 5 アルコキシ基(トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基等)、ニトロ基、シアノ基及びハロゲン原子(フッ素原子、塩素原子、臭素原子等)からなる群より選ばれる一種以上で置換されていてもよいフェニル基で置換されたC1-C2アルキル基が挙げられ、具体的には例えば、ベンジル基、2-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、4-メチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、2-メチルチオベンジル基、3-メチルチオベンジル基、4-メチルチオベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、2-ニトロベンジル基、3-ニトロベンジル基、4-ニトロベンジル基、2-シアノベンジル基、3-シアノベンジル基、4-シアノベンジル基、2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、3,4-ジフルオロベンジル基、3,5-ジフルオロベンジル基、2,6-ジフルオロベンジル基、2,4-ジフルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、3,4-ジクロロベンジル基、3,5-ジクロロベンジル基、2,6-ジクロロベンジル基、2,4-ジクロロベンジル基、2-ブロモベンジル基、3-ブロモベンジル基、4-ブロモベンジル基、3,4-ジブロモベンジル基、3,5-ジブロモベンジル基、2,6-ジブロモベンジル基、2,4-ジブロモベンジル基、1-フェニルエチル基、
- 10 1-(2-メチルフェニル)エチル基、1-(3-メチルフェニル)エチル基、1-(4-メチルフェニル)エチル基、1-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、1-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、1-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、1-(2-メトキシフェニル)エチル基、1-(3-メトキシフェニル)エチル基、1-(4-メトキシフェニル)エチル
- 15 25

基、1-(2-メチルチオフェニル)エチル基、1-(3-メチルチオフェニル)
エチル基、1-(4-メチルチオフェニル)エチル基、1-(2-トリフルオロ
メトキシフェニル)エチル基、1-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エチ
ル基、1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、1-(2-ニトロ
5 フェニル)エチル基、1-(3-ニトロフェニル)エチル基、1-(4-ニトロ
フェニル)エチル基、1-(2-シアノフェニル)エチル基、1-(3-シアノ
フェニル)エチル基、1-(4-シアノフェニル)エチル基、1-(2-フルオ
ロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フ
ルオロフェニル)エチル基、1-(3,4-ジフルオロフェニル)エチル基、1
10 - (3,5-ジフルオロフェニル)エチル基、1-(2,6-ジフルオロフェニ
ル)エチル基、1-(2,4-ジフルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロ
ロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロ
ロフェニル)エチル基、1-(3,4-ジクロロフェニル)エチル基、1-(3,
5-ジクロロフェニル)エチル基、1-(2,6-ジクロロフェニル)エチル基、
15 1-(2,4-ジクロロフェニル)エチル基、1-(2-ブロモフェニル)エチ
ル基、1-(3-ブロモフェニル)エチル基、1-(4-ブロモフェニル)エチ
ル基、1-(3,4-ジブロモフェニル)エチル基、1-(3,5-ジブロモフ
ェニル)エチル基、1-(2,6-ジブロモフェニル)エチル基、1-(2,4
-ジブロモフェニル)エチル基、2-フェニルエチル基、2-(2-メチルフェ
20 ニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェ
ニル)エチル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(3
-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェ
ニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシ
フェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-メチ
25 ルチオフェニル)エチル基、2-(3-メチルチオフェニル)エチル基、2-(4
-メチルチオフェニル)エチル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)
エチル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(4-ト
リフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(2-ニトロフェニル)エチル基、
2-(3-ニトロフェニル)エチル基、2-(4-ニトロフェニル)エチル基、

2- (2-シアノフェニル) エチル基、2- (3-シアノフェニル) エチル基、
2- (4-シアノフェニル) エチル基、2- (2-フルオロフェニル) エチル基、
2- (3-フルオロフェニル) エチル基、2- (4-フルオロフェニル) エチル
基、2- (3, 4-ジフルオロフェニル) エチル基、2- (3, 5-ジフルオロ
5 フェニル) エチル基、2- (2, 6-ジフルオロフェニル) エチル基、2- (2,
4-ジフルオロフェニル) エチル基、2- (2-クロロフェニル) エチル基、2
- (3-クロロフェニル) エチル基、2- (4-クロロフェニル) エチル基、2
- (3, 4-ジクロロフェニル) エチル基、2- (3, 5-ジクロロフェニル)
エチル基、2- (2, 6-ジクロロフェニル) エチル基、2- (2, 4-ジクロ
10 ロフェニル) エチル基、2- (2-ブロモフェニル) エチル基、2- (3-プロ
モフェニル) エチル基、2- (4-ブロモフェニル) エチル基、2- (3, 4-
ジブロモフェニル) エチル基、2- (3, 5-ジブロモフェニル) エチル基、2
- (2, 6-ジブロモフェニル) エチル基及び2- (2, 4-ジブロモフェニル)
エチル基が挙げられる。

15 R¹ で示される、置換されていてもよいフェニルオキシ基で置換されたC 1-
C 2アルキル基としては、例えばC 1-C 4アルキル基 (メチル基、エチル基、
プロピル基、イソプロピル基、tert-ブチル基等)、C 1-C 4ハロアルキル
基 (トリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基等)、
C 1-C 4アルコキシ基 (メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポ
20 キシ等)、C 1-C 4アルキルチオ基 (メチルチオ基、エチルチオ基等)、C 1-
C 2ハロアルコキシ基 (トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基等)、ニ
トロ基、シアノ基及びハロゲン原子 (フッ素原子、塩素原子、臭素原子等) から
なる群より選ばれる一種以上で置換されていてもよいフェニルオキシ基で置換さ
れたC 1-C 2アルキル基が挙げられ、具体的には例えばフェニルオキシメチル
25 基、1- (フェニルオキシ) エチル基、2- (フェニルオキシ) エチル基、(2-
メチルフェニル) オキシメチル基、(3-メチルフェニル) オキシメチル基、(4-
メチルフェニル) オキシメチル基、(2-トリフルオロメチルフェニル) オキシ
メチル基、(3-トリフルオロメチルフェニル) オキシメチル基、(4-トリフル
オロメチルフェニル) オキシメチル基、(2-メトキシフェニル) オキシメチル基、

- (3-メトキシフェニル) オキシメチル基、(4-メトキシフェニル) オキシメチル基、(2-メチルチオフェニル) オキシメチル基、(3-メチルチオフェニル) オキシメチル基、(4-メチルチオフェニル) オキシメチル基、(2-トリフルオロメトキシフェニル) オキシメチル基、(3-トリフルオロメトキシフェニル) オキシメチル基、(4-トリフルオロメトキシフェニル) オキシメチル基、(2-ニトロフェニル) オキシメチル基、(3-ニトロフェニル) オキシメチル基、(4-ニトロフェニル) オキシメチル基、(2-シアノフェニル) オキシメチル基、(3-シアノフェニル) オキシメチル基、(4-シアノフェニル) オキシメチル基、(2-フルオロフェニル) オキシメチル基、(3-フルオロフェニル) オキシメチル基、(4-フルオロフェニル) オキシメチル基、(3, 4-ジフルオロフェニル) オキシメチル基、(3, 5-ジフルオロフェニル) オキシメチル基、(2, 6-ジフルオロフェニル) オキシメチル基、(2, 4-ジフルオロフェニル) オキシメチル基、(2-クロロフェニル) オキシメチル基、(3-クロロフェニル) オキシメチル基、(4-クロロフェニル) オキシメチル基、(3, 4-ジクロロフェニル) オキシメチル基、(3, 5-ジクロロフェニル) オキシメチル基、(2, 6-ジクロロフェニル) オキシメチル基、(2, 4-ジクロロフェニル) オキシメチル基、(2-ブロモフェニル) オキシメチル基、(3-ブロモフェニル) オキシメチル基、(4-ブロモフェニル) オキシメチル基、(3, 4-ジブロモフェニル) オキシメチル基、(3, 5-ジブロモフェニル) オキシメチル基、(2, 6-ジブロモフェニル) オキシメチル基及び(2, 4-ジブロモフェニル) オキシメチル基が挙げられる。

R¹ で示される、置換されていてもよいフェニル基で置換されたC2-C3アルコキシアルキル基としては、例えばC1-C4アルキル基(メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、tert-ブチル基等)、C1-C4ハロアルキル基(トリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基等)、C1-C4アルコキシ基(メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ等)、C1-C4アルキルチオ基(メチルチオ基、エチルチオ基等)、C1-C2ハロアルコキシ基(トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基等)、ニトロ基、シアノ基及びハロゲン原子(フッ素原子、塩素原子、臭素原子等)からなる群より選ばれる一種以上で置換されていてもよいフェニル基で置換された

メトキシメチル基が挙げられ、具体的には例えばベンジルオキシメチル基、(2-メチルベンジル) オキシメチル基、(3-メチルベンジル) オキシメチル基、(4-メチルベンジル) オキシメチル基、(2-トリフルオロメチルベンジル) オキシメチル基、(3-トリフルオロメチルベンジル) オキシメチル基、(4-トリフル
5 オロメチルベンジル) オキシメチル基、(2-メトキシベンジル) オキシメチル基、
(3-メトキシベンジル) オキシメチル基、(4-メトキシベンジル) オキシメチル基、(2-メチルチオベンジル) オキシメチル基、(3-メチルチオベンジル) オキシメチル基、(4-メチルチオベンジル) オキシメチル基、(2-トリフルオ
10 ロメトキシベンジル) オキシメチル基、(3-トリフルオロメトキシベンジル) オキシメチル基、(4-トリフルオロメトキシベンジル) オキシメチル基、(2-ニ
トロベンジル) オキシメチル基、(3-ニトロベンジル) オキシメチル基、(4-
ニトロベンジル) オキシメチル基、(2-シアノベンジル) オキシメチル基、(3-
シアノベンジル) オキシメチル基、(4-シアノベンジル) オキシメチル基、(2-
フルオロベンジル) オキシメチル基、(3-フルオロベンジル) オキシメチル基、
15 (4-フルオロベンジル) オキシメチル基、(3, 4-ジフルオロベンジル) オキシ
メチル基、(3, 5-ジフルオロベンジル) オキシメチル基、(2, 6-ジフル
オロベンジル) オキシメチル基、(2, 4-ジフルオロベンジル) オキシメチル基、
(2-クロロベンジル) オキシメチル基、(3-クロロベンジル) オキシメチル基、
(4-クロロベンジル) オキシメチル基、(3, 4-ジクロロベンジル) オキシメ
20 チル基、(3, 5-ジクロロベンジル) オキシメチル基、(2, 6-ジクロロベン
ジル) オキシメチル基、(2, 4-ジクロロベンジル) オキシメチル基、(2-ブ
ロモベンジル) オキシメチル基、(3-ブロモベンジル) オキシメチル基、(4-
ブロモベンジル) オキシメチル基、(3, 4-ジブロモベンジル) オキシメチル基、
(3, 5-ジブロモベンジル) オキシメチル基、(2, 6-ジブロモベンジル) オ
25 キシメチル基、(2, 4-ジブロモベンジル) オキシメチル基が挙げられる。

R¹ で示される式 (B) で示される基としては、例えば R³ が C1-C3 アルキル基であり、R⁴ が水素原子、又は C1-C4 アルキル基 (メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、tert-ブチル基等)、C1-C4 ハロアルキル基 (トリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、ペンタフルオロメチル基等)、

C1-C4アルコキシ基（メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ等）、C1-C4アルキルチオ基（メチルチオ基、エチルチオ基等）、C1-C2ハロアルコキシ基（トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基等）、ニトロ基、シアノ基及びハロゲン原子（フッ素原子、塩素原子、臭素原子等）からなる群より選ばれる一種以上で置換されていてもよいフェニル基が挙げられ、具体的には例えばアセトキシメチル基及び α -アセチルオキシベンジル基が挙げられる。

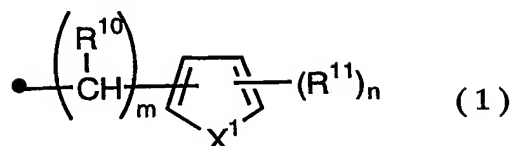
R^2 で示される、置換されていてもよい〔異項原子として酸素原子または硫黄原子のみを有す5員の複素環基（以下、本複素環基と記す。）〕で置換されたC1-C4アルキル基としては、例えばC1-C4アルキル基（メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、tert-ブチル基等）、ハロゲン原子（フッ素原子、塩素原子、臭素原子等）、トリフルオロメチル基、ホルミル基及びニトロ基からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよい本複素環基で置換されたC1-C4アルキル基が挙げられ、具体的には例えばハロゲン原子（フッ素原子、塩素原子、臭素原子等）、C1-C4アルキル基（メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、tert-ブチル基等）、トリフルオロメチル基、ホルミル基及びニトロ基からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよい本複素環基で置換されたメチル基、及びC1-C4アルキル基（メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、tert-ブチル基等）、ハロゲン原子（フッ素原子、塩素原子、臭素原子等）、トリフルオロメチル基、ホルミル基及びニトロ基からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよい本複素環基で1位が置換されたエチル基が挙げられる。

R^2 で示される、置換されていてもよい本複素環基で置換されたC1-C4アルキル基における、本複素環基としては、例えば異項原子として酸素原子のみを有する5員環基、異項原子として酸素原子のみを有す飽和の5員環基、異項原子として2つの酸素原子のみを有する5員環基、異項原子として1つの酸素原子のみを有する5員環基、異項原子として硫黄原子のみを有する5員環基が挙げられる。

R^2 で示される、置換されていてもよい本複素環基で置換されたC1-C4アルキル基の態様としては、例えば下式（1）～式（10）で示される基が挙げら

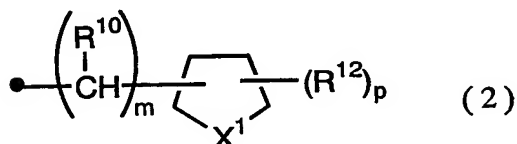
れる。

式 (1)



(式中、 R^{10} は水素原子又はメチル基を表し、 R^{11} はハロゲン原子、C 1－C 4
5 アルキル基、トリフルオロメチル基、ホルミル基又はニトロ基を表し、 X^1 は酸
素原子又は硫黄原子を表し、 m は 1 又は 2 を表し、 n は 0～3 の整数を表す。な
お、 n が 2 以上の整数である場合には各々の R^{11} は同一でも相異なってもよ
い。);

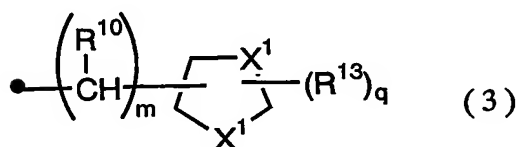
式 (2)



10

(式中、 R^{10} は水素原子又はメチル基を表し、 R^{12} は C 1－C 4 アルキル基を表
し、 X^1 は酸素原子又は硫黄原子を表し、 m は 1 又は 2 を表し、 p は 0～7 の整
数を表す。なお、 p が 2 以上の整数である場合には各々の R^{12} は同一でも相異な
っていてもよい。);

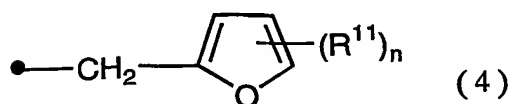
15 式 (3)



(式中、 R^{10} は水素原子又はメチル基を表し、 R^{13} は C 1－C 4 アルキル基を表
し、 X^1 は酸素原子又は硫黄原子を表し、 m は 1 又は 2 を表し、 q は 0～5 の整
数を表す。なお、 q が 2 以上の整数である場合には各々の R^{13} は同一でも相異な
20

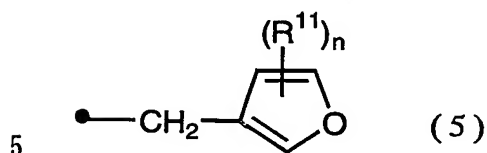
っていてもよい。);

式 (4)



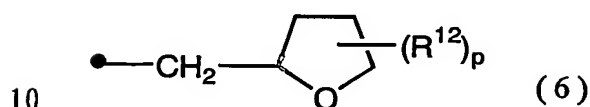
(式中、 R^{11} はハロゲン原子、C 1－C 4アルキル基、トリフルオロメチル基、ホルミル基又はニトロ基を表し、 n は0～3の整数を表す。なお、 n が2以上の整数である場合には各々の R^{11} は同一でも相異なってもよい。);

式 (5)



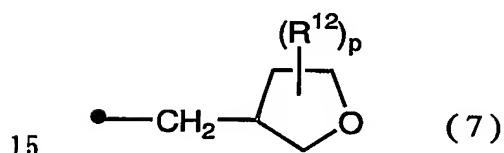
(式中、 R^{11} はハロゲン原子、C 1－C 4アルキル基、トリフルオロメチル基、ホルミル基又はニトロ基を表し、 n は0～3の整数を表す。 n が2以上の整数である場合には各々の R^{11} は同一でも相異なってもよい。);

式 (6)



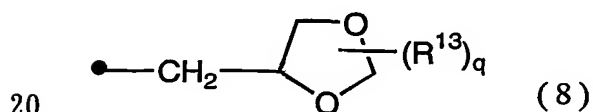
(式中、 R^{12} はC 1－C 4アルキル基を表し、 p は0～7の整数を表す。なお、 p が2以上の整数である場合には各々の R^{12} は同一でも相異なってもよい。);

式 (7)



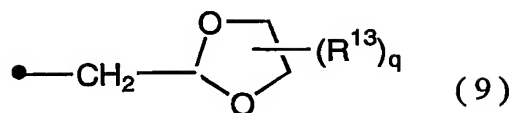
(式中、 R^{12} はC 1－C 4アルキル基を表し、 p は0～7の整数を表す。なお、 p が2以上の整数である場合には各々の R^{12} は同一でも相異なってもよい。);

式 (8)



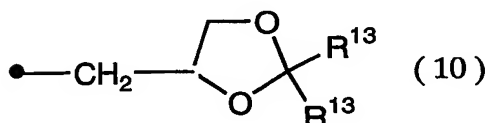
(式中、 R^{13} はC 1－C 4アルキル基を表し、 q は0～5の整数を表す。なお、 q が2以上の整数である場合には各々の R^{13} は同一でも相異なってもよい。);

式 (9)



(式中、 R^{13} はC 1－C 4アルキル基を表し、 q は0～5の整数を表す。なお、 q が2以上の整数である場合には各々の R^{13} は同一でも相異なってもよい。);

式 (10)



(式中、 R^{13} はC 1－C 4アルキル基を表す。なお、2個の R^{13} は同一でも相異なってもよい。);

10

本発明化合物の態様としては、例えば以下の化合物が挙げられる。

式 (A) において R^1 がC 1－C 7アルキル基であるチアジアゾール化合物;

式 (A) において R^1 がC 3－C 7アルケニル基、C 2－C 7アルコキシアルキル基、C 2－C 7アルキルチオアルキル基、C 4－C 7アルコキシアルコキシアルキル基又はC 4－C 7アルキルチオアルコキシアルキル基であるチアジアゾール化合物;

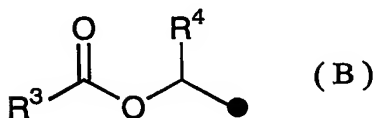
式 (A) において R^1 が置換基群Aより選ばれる1種以上で置換されていてもよいフェニル基、置換基群Aより選ばれる1種以上で置換されていてもよいフェニル基で置換されたC 1－C 2アルキル基、置換基群Aより選ばれる1種以上で置換されていてもよいフェニルオキシ基で置換されたC 1－C 2アルキル基又は置換基群Aより選ばれる1種以上で置換されていてもよいフェニル基で置換されたC 2－C 3アルコキシアルキル基であるチアジアゾール化合物

置換基群A

「C 1－C 4アルキル基、C 1－C 4ハロアルキル基、C 1－C 4アルコキシ基、C 1－C 4アルキルチオ基、C 1－C 4ハロアルコキシ基、ニトロ基、シアノ基及びハロゲン原子。」;

25

式 (A) において R^1 が式 (B)

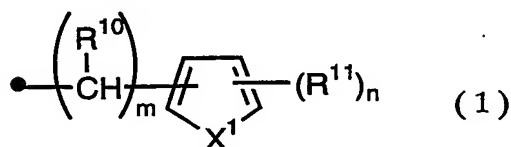


- 5 [式中、 R^3 は C 1 - C 3 アルキル基を表し、 R^4 は水素原子、メチル基、エチル基、又は、C 1 - C 4 アルキル基、C 1 - C 4 ハロアルキル基、C 1 - C 4 アルコキシ基、C 1 - C 4 アルキルチオ基、C 1 - C 4 ハロアルコキシ基、ニトロ基、シアノ基及びハロゲン原子からなる群より選ばれる 1 種以上で置換されていてもよいフェニル基を表す。]

で示される基であるチアジアゾール化合物；

- 10 式 (A) において R^1 が置換基群 A より選ばれる 1 種以上で置換されていてもよいフェニル基、置換基群 A より選ばれる 1 種以上で置換されていてもよいベンジル基、置換基群 A より選ばれる 1 種以上で置換されていてもよいフェニルオキシメチル基又は置換基群 A より選ばれる 1 種以上で置換されていてもよいベンジロキシメチル基であるチアジアゾール化合物；

式 (A) において R^2 が式 (1)

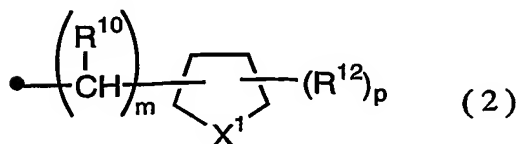


15

- [式中、 R^{10} は水素原子又はメチル基を表し、 R^{11} はハロゲン原子、C 1 - C 4 アルキル基、トリフルオロメチル基、ホルミル基又はニトロ基を表し、 X^1 は酸素原子又は硫黄原子を表し、 m は 1 又は 2 を表し、 n は 0 ~ 3 の整数を表す。なお、 n が 2 以上の整数である場合には各々の R^{11} は同一でも相異なってもよい。]

20

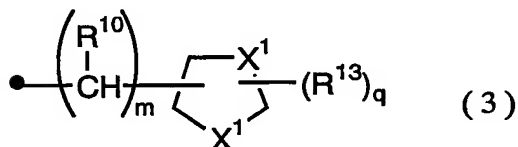
で示される基、式 (2)



[式中、 R^{10} は水素原子又はメチル基を表し、 R^{12} は C 1 - C 4 アルキル基を表

し、 X^1 は酸素原子又は硫黄原子を表し、 m は1又は2を表し、 p は0～7の整数を表す。なお、 p が2以上の整数である場合には各々の R^{12} は同一でも相異なっているてもよい。]

で示される基、または式(3)

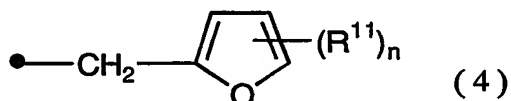


5

[式中、 R^{10} は水素原子又はメチル基を表し、 R^{13} はC1-C4アルキル基を表し、 X^1 は酸素原子又は硫黄原子を表し、 m は1又は2を表し、 q は0～5の整数を表す。なお、 q が2以上の整数である場合には各々の R^{13} は同一でも相異なっているてもよい。]

10 で示される基であるチアジアゾール化合物；

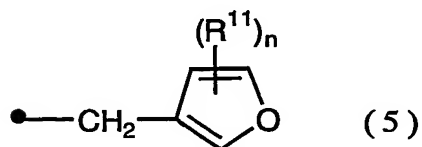
式(A)において R^1 が式(4)



[式中、 R^{11} はハロゲン原子、C1-C4アルキル基、トリフルオロメチル基、ホルミル基又はニトロ基を表し、 n は0～3の整数を表す。なお、 n が2以上の整数である場合には各々の R^{11} は同一でも相異なっているてもよい。]

15

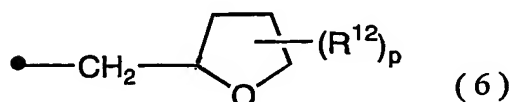
で示される基、式(5)



[式中、 R^{11} はハロゲン原子、C1-C4アルキル基、トリフルオロメチル基、ホルミル基又はニトロ基を表し、 n は0～3の整数を表す。 n が2以上の整数である場合には各々の R^{11} は同一でも相異なっているてもよい。]

20

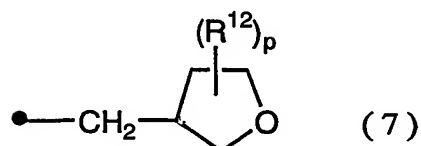
で示される基、式(6)



[式中、 R^{12} はC1-C4アルキル基を表し、 p は0～7の整数を表す。なお、

p が 2 以上の整数である場合には各々の R^{12} は同一でも相異なっているもよい。]

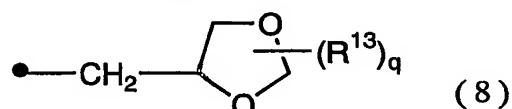
で示される基、式 (7)



[式中、 R^{12} は C 1 - C 4 アルキル基を表し、p は 0 ~ 7 の整数を表す。なお、

5 p が 2 以上の整数である場合には各々の R^{12} は同一でも相異なっているもよい。]

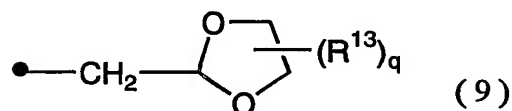
で示される基、式 (8)



[式中、 R^{13} は C 1 - C 4 アルキル基を表し、q は 0 ~ 5 の整数を表す。なお、

10 q が 2 以上の整数である場合には各々の R^{13} は同一でも相異なっているもよい。]

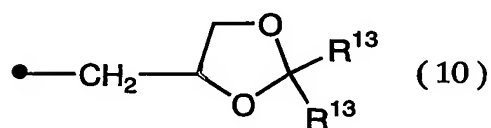
で示される基、式 (9)



[式中、 R^{13} は C 1 - C 4 アルキル基を表し、q は 0 ~ 5 の整数を表す。なお、

q が 2 以上の整数である場合には各々の R^{13} は同一でも相異なっているもよい。]

で示される基、または式 (10)



[式中、 R^{13} は C 1 - C 4 アルキル基を表す。なお、2 個の R^{13} は同一でも相異なっているもよい。]

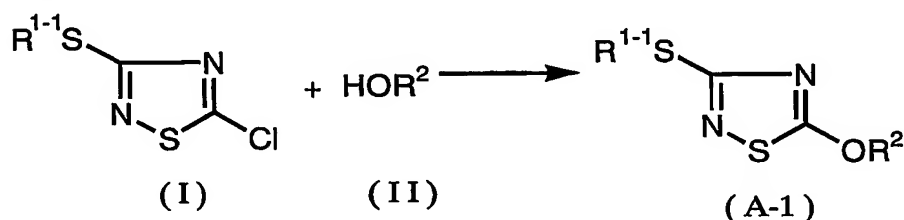
で示される基であるチアジアゾール化合物。

20 次に本発明化合物の製造法について説明する。

本発明化合物のうち、

R^1 が C 1 - C 7 アルキル基、C 3 - C 7 アルケニル基、C 3 - C 7 アルキニル基、C 2 - C 7 アルコキシアルキル基、C 2 - C 7 アルキルチオアルキル基、C

4-C7アルコキシアルコキシアルキル基、C4-C7アルキルチオアルコキシアルキル基、置換されていてもよいフェニル基、(置換されていてもよいフェニル) C1-C2アルキル基、(置換されていてもよいフェニルオキシ) C1-C2アルキル基又は(置換されていてもよいフェニル) C2-C3アルコキシアルキル基である化合物(式(A-1)で示される化合物)は例えば式(I)で示される5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール化合物と式(II)で示されるアルコール化合物とを反応させることにより製造することができる。



(式中、R¹⁻¹はC1-C7アルキル基、C3-C7アルケニル基、C3-C7アルキニル基、C2-C7アルコキシアルキル基、C2-C7アルキルチオアルキル基、C4-C7アルコキシアルコキシアルキル基、C4-C7アルキルチオアルコキシアルキル基、置換されていてもよいフェニル基、(置換されていてもよいフェニル) C1-C2アルキル基、(置換されていてもよいフェニルオキシ) C1-C2アルキル基又は(置換されていてもよいフェニル) C2-C3アルコキシアルキル基を表し、R²は前記と同じ意味を表す。)

該反応は通常塩基の存在下、通常溶媒中で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン、メチル-tert-ブチルエーテル、1, 2-ジメトキシエタン等のエーテル類、N, N-ジメチルホルムアミド及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば炭酸カリウム、炭酸ナトリウム等の炭酸塩及びこれらの混合物が挙げられる。

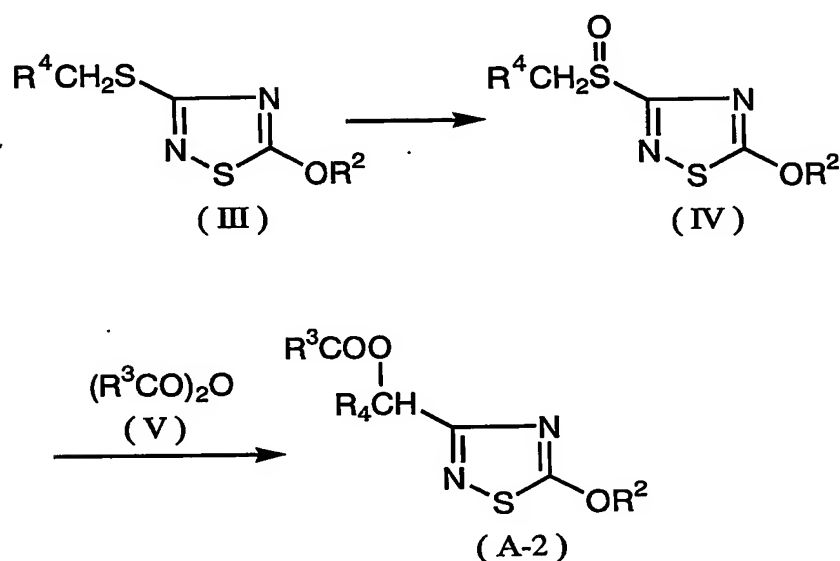
反応に用いられる試剤の量は、式(I)で示される5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール化合物1モルに対して、式(II)で示されるアルコール化合物が通常1~1.5モルの割合であり、塩基が式(II)で示されるアルコール化

合物 1 モルに対して通常 1 ～ 1.5 モルの割合である。

該反応の反応温度は通常 $-20 \sim 80^{\circ}\text{C}$ の範囲、反応時間は通常 0.5 ～ 24 時間の範囲である。

5 反応終了後は、例えば反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出して得られる有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式 (A-1) で示される本発明化合物を単離することができる。単離した式 (A-1) で示される本発明化合物は必要に応じてクロマトグラフィー、再結晶等の操作によりさらに精製することもできる。

10 本発明化合物のうち、 R^1 が式 (B) で示される基である化合物 (式 (A-2) で示される化合物) は例えば式 (III) で示されるチアジアゾール化合物と酸化剤とを反応させ (前半工程)、次いで式 (V) で示される酸無水物とを反応させる (後半工程) ことにより製造することができる。



(式中、 R^2 、 R^3 及び R^4 は前記と同じ意味を表す。)

15 (前半工程)

前半工程の反応は通常溶媒中で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類及び水が挙げられる。

20 該反応に用いられる酸化剤としては例えば 3-クロロ過安息香酸等の過酸が挙げられる。反応に用いられる酸化剤の量は式 (III) で示されるチアジアゾール

ル化合物 1 モルに対して通常 1 ～ 1.5 モルの割合である。

該反応の反応温度は通常 $-20 \sim 30^{\circ}\text{C}$ の範囲であり、反応時間は通常瞬時～24 時間の範囲である。

5 反応終了後は、例えば反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出して得られた有機層を必要に応じて還元剤（亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム等）の水溶液、塩基（炭酸水素ナトリウム等）の水溶液等で洗浄し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより式（I V）で示されるスルホキシド化合物を単離することができる。単離した式（I V）で示されるスルホキシド化合物は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

10 （後半工程）

後半工程は式（I V）で示されるスルホキシド化合物と式（V）で示される酸無水物とを反応させることにより行われる。

該反応は溶媒の存在下又は非存在下、通常塩基の存在下で行われる。

15 反応に用いられる塩基としては、例えば 2, 6-アルチジン等のピリジン類及び酢酸ナトリウム等の酢酸のアルカリ金属塩が挙げられる。

反応に用いられる試剤の量は式（I V）で示されるスルホキシド化合物 1 モルに対して、式（V）で示される酸無水物が 1 ～ 50 モルの割合であり、塩基が 1 ～ 10 モルの割合である。

該反応は、必要に応じてトリフルオロ酢酸無水物の存在下で行うこともできる。

20 この場合のトリフルオロ酢酸無水物の量は式（I V）で示されるスルホキシド化合物 1 モルに対して 0.01 ～ 5 モルの割合である。

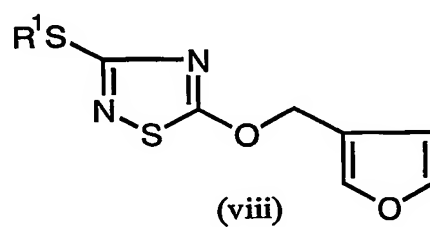
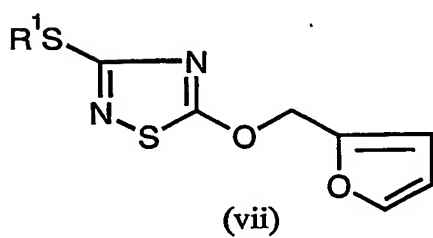
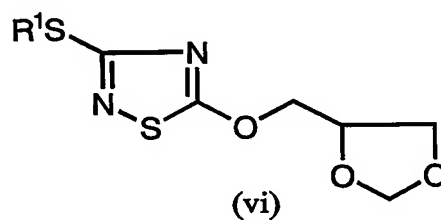
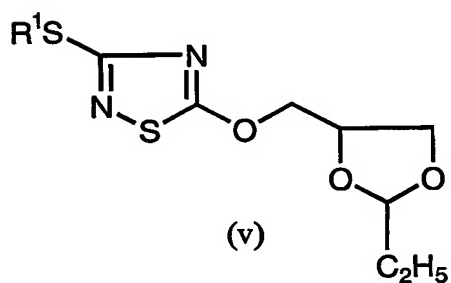
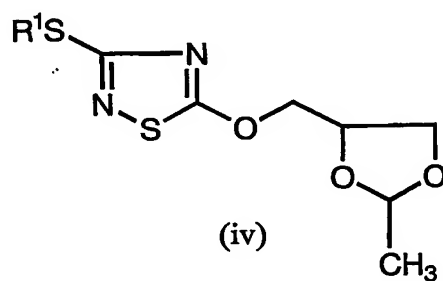
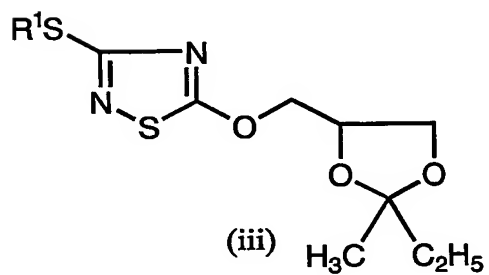
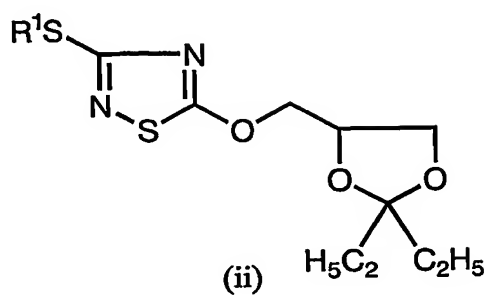
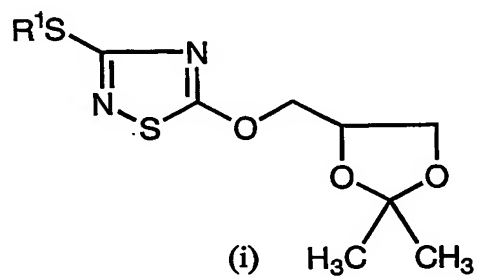
該反応の反応温度は通常 $0 \sim 150^{\circ}\text{C}$ の範囲であり、反応時間は通常 1 ～ 72 時間の範囲である。

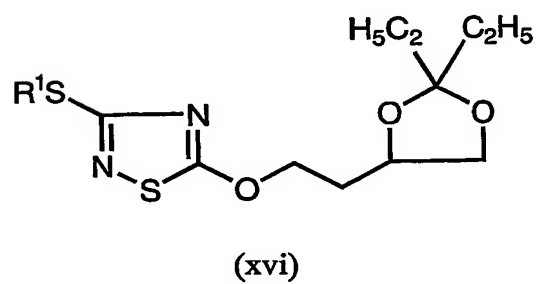
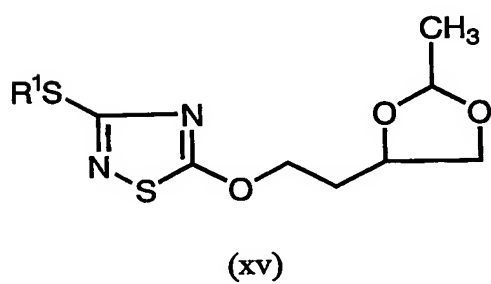
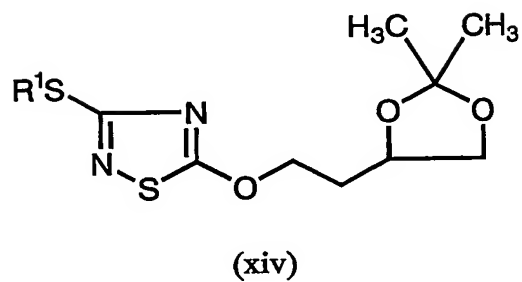
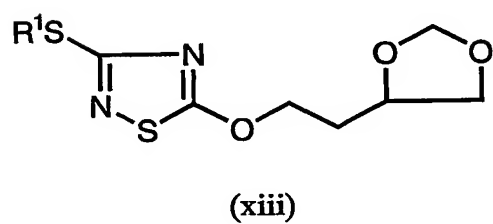
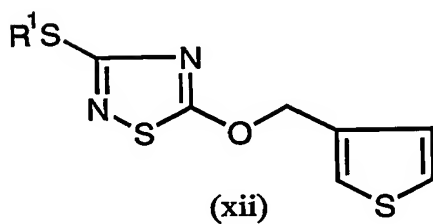
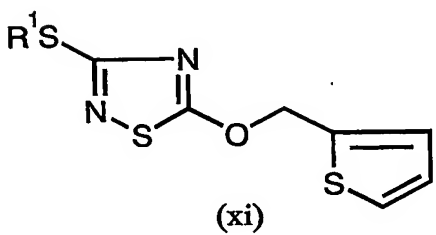
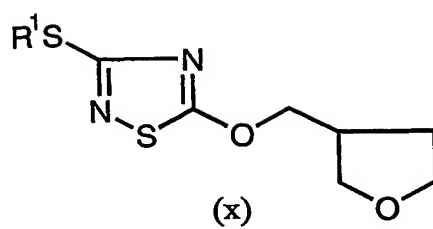
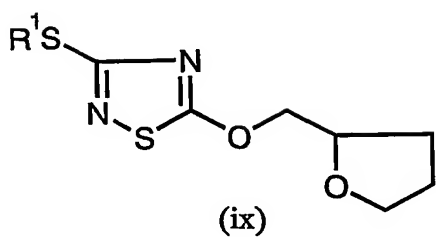
25 反応終了後は、例えば反応混合物を塩基（炭酸水素ナトリウム等）の水溶液に注加し、有機溶媒抽出して得られる有機層を、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式（A-2）で示される本発明化合物を単離することができる。単離した式（A-2）で示される本発明化合物は、必要に応じてクロマトグラフィー、再結晶等の操作によりさらに精製することもできる。

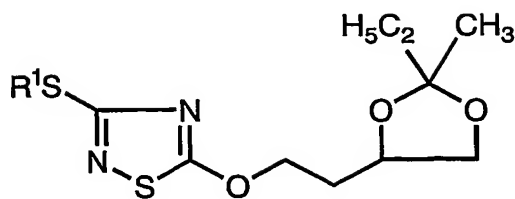
式（I）で示される化合物は例えば Chem. Ber. 90, 892 (195

7) に記載された方法に準じて製造することができる。

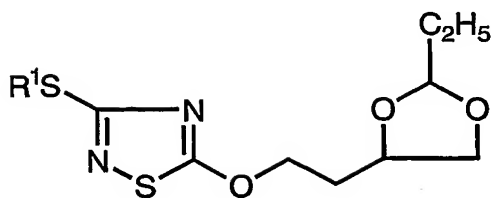
次に、本化合物の一例を示す。



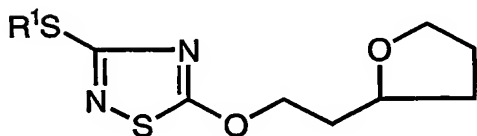




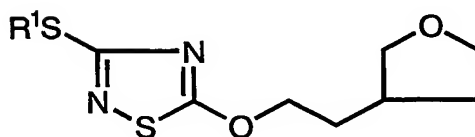
(xvii)



(xviii)



(xix)



(xx)

式 (i) ~ 式 (xx) において R¹ は、

メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、

- 5 アリル基、2-ブテニル基、3-メチル-2-ブテニル基、2-ペンテニル基、2-プロピニル基、1-メチル-2-プロピニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、2-ペンチニル基、

メトキシメチル基、エトキシメチル基、プロポキシメチル基、イソプロポキシメチル基、ブトキシメチル基、イソブトキシメチル基、*sec*-ブトキシメチル基、

- 10 *tert*-ブトキシメチル基、

メチルチオメチル基、エチルチオメチル基、プロピルチオメチル基、イソプロピルチオメチル基

メトキシエトキシメチル基、エトキシエトキシメチル基、

メチルチオエトキシメチル基、

- 15 フェニル基、

2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、

2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、

2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、

- 2-メチルチオフェニル基、3-メチルチオフェニル基、4-メチルチオフェニル基、
- 2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、
- 5 2-ニトロフェニル基、3-ニトロフェニル基、4-ニトロフェニル基、
- 2-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、4-シアノフェニル基、
- 2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、
- 3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、
- 10 2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、
- 2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、3, 4-ジブロモフェニル基、3, 5-ジブロモフェニル基、2, 6-ジブロモフェニル基、
- 15 2, 4-ジブロモフェニル基、
- ベンジル基、
- 2-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、4-メチルベンジル基、
- 2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、
- 20 2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、
- 2-メチルチオベンジル基、3-メチルチオベンジル基、4-メチルチオベンジル基、
- 2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、
- 25 2-ニトロベンジル基、3-ニトロベンジル基、4-ニトロベンジル基、
- 2-シアノベンジル基、3-シアノベンジル基、4-シアノベンジル基、
- 2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、
- 3, 4-ジフルオロベンジル基、3, 5-ジフルオロベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジル基、

- 2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、3, 4-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、2, 6-ジクロロベンジル基、2, 4-ジクロロベンジル基、
- 2-ブロモベンジル基、3-ブロモベンジル基、4-ブロモベンジル基、3, 4-ジブロモベンジル基、3, 5-ジブロモベンジル基、2, 6-ジブロモベンジル基、2, 4-ジブロモベンジル基、
- 1-(フェニル)エチル基、
- 1-(2-メチルフェニル)エチル基、1-(3-メチルフェニル)エチル基、
- 1-(4-メチルフェニル)エチル基、
- 10 1-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、1-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、1-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、
- 1-(2-メトキシフェニル)エチル基、1-(3-メトキシフェニル)エチル基、1-(4-メトキシフェニル)エチル基、
- 1-(2-メチルチオフェニル)エチル基、1-(3-メチルチオフェニル)エチル基、
- 15 1-(4-メチルチオフェニル)エチル基、
- 1-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、1-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、
- 1-(2-ニトロフェニル)エチル基、1-(3-ニトロフェニル)エチル基、
- 20 1-(4-ニトロフェニル)エチル基、
- 1-(2-シアノフェニル)エチル基、1-(3-シアノフェニル)エチル基、
- 1-(4-シアノフェニル)エチル基、
- 1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(3, 4-ジフルオロフェニル)エチル基、1-(3, 5-ジフルオロフェニル)エチル基、1-(2, 6-ジフルオロフェニル)エチル基、1-(2, 4-ジフルオロフェニル)エチル基、
- 25 1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、
- 1-(4-クロロフェニル)エチル基、1-(3, 4-ジクロロフェニル)エチル基、1-(3, 5-ジクロロフェニル)エチル基、1-(2, 6-ジクロロフェニル)エチル基、

- エニル) エチル基、 1- (2, 4-ジクロロフェニル) エチル基、
1- (2-プロモフェニル) エチル基、 1- (3-プロモフェニル) エチル基、
1- (4-プロモフェニル) エチル基、 1- (3, 4-ジプロモフェニル) エチル基、 1- (3, 5-ジプロモフェニル) エチル基、 1- (2, 6-ジプロモフェニル) エチル基、
5 エニル) エチル基、 1- (2, 4-ジプロモフェニル) エチル基、
2- (フェニル) エチル基、
2- (2-メチルフェニル) エチル基、 2- (3-メチルフェニル) エチル基、
2- (4-メチルフェニル) エチル基、
2- (2-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、 2- (3-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、
10 2- (4-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、
2- (2-メトキシフェニル) エチル基、 2- (3-メトキシフェニル) エチル基、
2- (4-メトキシフェニル) エチル基、
2- (2-メチルチオフェニル) エチル基、 2- (3-メチルチオフェニル) エチル基、
2- (4-メチルチオフェニル) エチル基、
15 2- (2-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、 2- (3-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、 2- (4-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、
2- (2-ニトロフェニル) エチル基、 2- (3-ニトロフェニル) エチル基、
2- (4-ニトロフェニル) エチル基、
20 2- (2-シアノフェニル) エチル基、 2- (3-シアノフェニル) エチル基、
2- (4-シアノフェニル) エチル基、
2- (2-フルオロフェニル) エチル基、 2- (3-フルオロフェニル) エチル基、
2- (4-フルオロフェニル) エチル基、 2- (3, 4-ジフルオロフェニル) エチル基、 2- (3, 5-ジフルオロフェニル) エチル基、 2- (2, 6-ジフルオロフェニル) エチル基、
25 2- (2, 4-ジフルオロフェニル) エチル基、
2- (2-クロロフェニル) エチル基、 2- (3-クロロフェニル) エチル基、
2- (4-クロロフェニル) エチル基、 2- (3, 4-ジクロロフェニル) エチル基、
2- (3, 5-ジクロロフェニル) エチル基、 2- (2, 6-ジクロロフェニル) エチル基、
2- (2, 4-ジクロロフェニル) エチル基、

- 2- (2-ブロモフェニル) エチル基、2- (3-ブロモフェニル) エチル基、
2- (4-ブロモフェニル) エチル基、2- (3, 4-ジブロモフェニル) エチル基、2- (3, 5-ジブロモフェニル) エチル基、2- (2, 6-ジブロモフェニル) エチル基、2- (2, 4-ジブロモフェニル) エチル基、
5 フェニルオキシメチル基、1- (フェニルオキシ) エチル基、2- (フェニルオキシ) エチル基、
(2-メチルフェニル) オキシメチル基、(3-メチルフェニル) オキシメチル基、
(4-メチルフェニル) オキシメチル基、
(2-トリフルオロメチルフェニル) オキシメチル基、(3-トリフルオロメチル
10 フェニル) オキシメチル基、(4-トリフルオロメチルフェニル) オキシメチル基、
(2-メトキシフェニル) オキシメチル基、(3-メトキシフェニル) オキシメチル基、
(4-メトキシフェニル) オキシメチル基、
(2-メチルチオフェニル) オキシメチル基、(3-メチルチオフェニル) オキシ
メチル基、(4-メチルチオフェニル) オキシメチル基、
15 (2-トリフルオロメトキシフェニル) オキシメチル基、(3-トリフルオロメト
キシフェニル) オキシメチル基、(4-トリフルオロメトキシフェニル) オキシメ
チル基、
(2-ニトロフェニル) オキシメチル基、(3-ニトロフェニル) オキシメチル基、
(4-ニトロフェニル) オキシメチル基、
20 (2-シアノフェニル) オキシメチル基、(3-シアノフェニル) オキシメチル基、
(4-シアノフェニル) オキシメチル基、
(2-フルオロフェニル) オキシメチル基、(3-フルオロフェニル) オキシメチ
ル基、(4-フルオロフェニル) オキシメチル基、(3, 4-ジフルオロフェニル)
オキシメチル基、(3, 5-ジフルオロフェニル) オキシメチル基、(2, 6-ジ
25 フルオロフェニル) オキシメチル基、(2, 4-ジフルオロフェニル) オキシメチ
ル基、
(2-クロロフェニル) オキシメチル基、(3-クロロフェニル) オキシメチル基、
(4-クロロフェニル) オキシメチル基、(3, 4-ジクロロフェニル) オキシメ
チル基、(3, 5-ジクロロフェニル) オキシメチル基、(2, 6-ジクロロフェ

- ニル) オキシメチル基、(2, 4-ジクロロフェニル) オキシメチル基、
(2-ブロモフェニル) オキシメチル基、(3-ブロモフェニル) オキシメチル基、
(4-ブロモフェニル) オキシメチル基、(3, 4-ジブロモフェニル) オキシメ
チル基、(3, 5-ジブロモフェニル) オキシメチル基、(2, 6-ジブロモフェ
5 ニル) オキシメチル基、(2, 4-ジブロモフェニル) オキシメチル基、
ベンジルオキシメチル基、
(2-メチルベンジル) オキシメチル基、(3-メチルベンジル) オキシメチル基、
(4-メチルベンジル) オキシメチル基、
(2-トリフルオロメチルベンジル) オキシメチル基、(3-トリフルオロメチル
10 ベンジル) オキシメチル基、(4-トリフルオロメチルベンジル) オキシメチル基、
(2-メトキシベンジル) オキシメチル基、(3-メトキシベンジル) オキシメチ
ル基、(4-メトキシベンジル) オキシメチル基、
(2-メチルチオベンジル) オキシメチル基、(3-メチルチオベンジル) オキシ
メチル基、(4-メチルチオベンジル) オキシメチル基、
15 (2-トリフルオロメトキシベンジル) オキシメチル基、(3-トリフルオロメト
キシベンジル) オキシメチル基、(4-トリフルオロメトキシベンジル) オキシメ
チル基、
(2-ニトロベンジル) オキシメチル基、(3-ニトロベンジル) オキシメチル基、
(4-ニトロベンジル) オキシメチル基、
20 (2-シアノベンジル) オキシメチル基、(3-シアノベンジル) オキシメチル基、
(4-シアノベンジル) オキシメチル基、
(2-フルオロベンジル) オキシメチル基、(3-フルオロベンジル) オキシメチ
ル基、(4-フルオロベンジル) オキシメチル基、(3, 4-ジフルオロベンジル)
オキシメチル基、(3, 5-ジフルオロベンジル) オキシメチル基、(2, 6-ジ
25 フルオロベンジル) オキシメチル基、(2, 4-ジフルオロベンジル) オキシメチ
ル基、
(2-クロロベンジル) オキシメチル基、(3-クロロベンジル) オキシメチル基、
(4-クロロベンジル) オキシメチル基、(3, 4-ジクロロベンジル) オキシメ
チル基、(3, 5-ジクロロベンジル) オキシメチル基、(2, 6-ジクロロベン

ジル) オキシメチル基、(2, 4-ジクロロベンジル) オキシメチル基、
(2-ブロモベンジル) オキシメチル基、(3-ブロモベンジル) オキシメチル基、
(4-ブロモベンジル) オキシメチル基、(3, 4-ジブロモベンジル) オキシメ
チル基、(3, 5-ジブロモベンジル) オキシメチル基、(2, 6-ジブロモベン
5 ジル) オキシメチル基、(2, 4-ジブロモベンジル) オキシメチル基、
アセチルオキシメチル基、プロピオニルオキシメチル基及び α -アセトキシベン
ジル基から選ばれるいずれかの基を表す。

本発明化合物が防除効力を示す有害節足動物としては、昆虫やダニ類、具体的
10 には例えば以下に示すものが挙げられる。

半翅目害虫：ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatellus*)、トビイロウン
カ (*Nilaparvata lugens*)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*)等のウンカ類、
ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*)、チャノミドリヒメヨコバイ
(*Empoasca onukii*)等のヨコバイ類、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*)、モモア
15 カアブラムシ (*Myzus persicae*)等のアブラムシ類、カメムシ類、オンシツコナジ
ラミ (*Trialeurodes vaporariorum*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、シル
バーリーフコナジラミ (*Bemisia argentifolii*)等のコナジラミ類、カイガラムシ
類、グンバイムシ類、キジラミ類等

鱗翅目害虫：ニカメイガ (*Chilo suppressalis*)、コブノメイガ
20 (*Cnaphalocrocis medinalis*)、ヨーロピアンコーンボラー (*Ostrinia
nubilalis*)、シバツトガ (*Parapediasia teterrella*)等のメイガ類、ハスモンヨ
トウ (*Spodoptera litura*)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*)、アワヨ
トウ (*Pseudaletia separata*)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、タマナヤガ
(*Agrotis ipsilon*)、トリコプルシア属 (*Trichoplusia* spp.)、ヘリオティス属
25 (*Heliothis* spp.)、ヘリコベルパ属 (*Helicoverpa* spp.)、エアリアス属 (*Earias*
spp.)等のヤガ類、モンシロチョウ (*Pieris rapae crucivora*)等のシロチョウ類、
リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*)、ナシヒメシンクイ
(*Grapholita molesta*)、コドリグモス (*Cydia pomonella*)等のハマキガ類、モ
モシンクイガ (*Carposina niponensis*)等のシンクイガ類、モモハモグリガ

(*Lyonetia clerkella*) 等のチビガ類、キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringoniella*) 等のホソガ類、ミカンハモグリガ (*Phyllocnistis citrella*) 等のコハモグリガ類、コナガ (*Plutela xylostella*) 等のスガ類、ピンクボールワーム (*Pectinophora gossypiella*) 等のキバガ類、ヒトリガ類、ヒロズコガ類等

- 5 双翅目害虫：アカイエカ (*Culex pipiens pallens*)、コガタアカイエカ (*Culex tritaeniorhynchus*)、ネッタイエカ (*Culex quinquefasciatus*) 等のイエカ類、(*Aedes aegypti*)、(*Aedes albopictus*) 等のエーデス属、(*Anopheles sinensis*) 等のアノフェレス属、ユスリカ類、イエバエ (*Musca domestica*)、オオイエバエ (*Muscina stabulans*) 等のイエバエ類、クロバエ類、ニクバエ類、ヒメイエバエ類、タネバエ (*Delia platura*)、タマネギバエ (*Delia antiqua*) 等のハナバエ類、ミバエ類、ショウジョウバエ類、チョウバエ類、ブユ類、アブ類、サシバエ類、ハモグリバエ類等
- 10

- 鞘翅目害虫：ウエスタンコーンルートワーム (*Diabrotica virgifera virgifera*)、サザンコーンルートワーム (*Diabrotica undecimpunctata howardi*)
- 15 等のコーンルートワーム類、ドウガネブイブイ (*Anomala cuprea*)、ヒメコガネ (*Anomala rufocuprea*) 等のコガネムシ類、メイズウィービル (*Sitophilus zeamais*)、イネミズゾウムシ (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、アズキゾウムシ (*Callosobruchus chienensis*) 等のゾウムシ類、チャイロコメノゴミムシダマシ (*Tenebrio molitor*)、コクヌストモドキ (*Tribolium castaneum*) 等のゴミムシ
- 20 シダマシ類、イネドロオイムシ (*Oulema oryzae*)、ウリハムシ (*Aulacophora femoralis*)、キスジノミハムシ (*Phyllotreta striolata*)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*) 等のハムシ類、シバンムシ類、ニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintioctopunctata*) 等のエピラクナ類、ヒラタキクイムシ類、ナガシンクイムシ類、カミキリムシ類、アオバアリガタハネカクシ (*Paederus*
- 25 *fuscipes*) 等；

アザミウマ目害虫：ミナミキイロアザミウマ (*Thrips palmi*) 等のスリップス属、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*) 等のフランクリニエラ属、チャノキイロアザミウマ (*Sciltothrips dorsalis*) 等のシルトスリップス属等のアザミウマ類、クダアザミウマ類等

膜翅目害虫：ハバチ類、アリ類、スズメバチ類等

網翅目害虫：ゴキブリ類、チャバネゴキブリ類等

直翅目害虫：バッタ類、ケラ類等

隠翅目害虫：ヒトノミ等

5 シラミ目害虫：ヒトジラミ等

シロアリ目害虫：シロアリ類等

ダニ目害虫：ハダニ類

本発明の有害節足動物防除剤は、本発明化合物と不活性な担体とを含有する。一般的には、本発明化合物と、固体担体、液体担体、ガス状担体及び／又は餌（
10 毒餌基材）等とを混合し、必要により界面活性剤、その他の製剤用補助剤を添加して得られる製剤である。製剤としては、油剤、乳剤、フロアブル剤、水和剤、粒剤、粉剤、マイクロカプセル剤等の形態が挙げられ、これらの製剤は、毒餌、シートに加工されて使用されることもある。本発明の有害節足防除剤とする。本発明の有害節足動物防除剤は、本発明化合物を通常0.01～95重量%含有す
15 る。

製剤化の際に用いられる固体担体としては、例えば粘土類（カオリンクレー、珪藻土、ベントナイト、フバサミクレー、酸性白土等）、合成含水酸化珪素、タルク類、セラミック、その他の無機鉱物（セリサイト、石英、硫黄、活性炭、炭酸カルシウム等）、化学肥料（硫安、硝安、塩安等）等の微粉末あるいは粒状物があ
20 げられる。液体担体としては、例えば水、アルコール類（メタノール、エタノール、2-プロパノール、エチレングリコール等）、ケトン類（アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、シクロヘキサノン等）、芳香族炭化水素類（トルエン、キシレン、エチルベンゼン、メチルナフタレン等）、脂肪族炭化水素類（ヘキサン、シクロヘキサン、灯油、軽油等）、エステル類（酢酸エチル、酢酸
25 ブチル等）、ニトリル類（アセトニトリル、イソブチロニトリル等）、エーテル類（エチレングリコールジメチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン等）、酸アミド類（N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド等）、ハロゲン化炭化水素類（ジクロロメタン、トリクロロエタン等）、ジメチルスルホキシド及び植物油（大豆油、綿実油等）があ

げられる。

ガス状担体としては、例えばフルオロカーボン、ブタンガス、LPG（液化石油ガス）、ジメチルエーテル及び二酸化炭素があげられる。

- 5 界面活性剤としては、例えばアルキル硫酸エステル塩、アルキルスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩、アルキルアリールエーテル類及びそのポリオキシエチレン化物、ポリエチレングリコールエーテル類、多価アルコールエステル類並びに糖アルコール誘導体があげられる。

- その他の製剤用補助剤としては、固着剤、分散剤及び安定剤等、具体的には例えばカゼイン、ゼラチン、糖類（でんぷん、アラビアガム、セルロース誘導体、
10 アルギン酸等）、リグニン誘導体、合成水溶性高分子（ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、ポリアクリル酸類等）、PAP（酸性りん酸イソプロピル）、BHT（2, 6-ジ-tert-ブチル-4-メチルフェノール）、BHA（2-tert-ブチル-4-メトキシフェノールと3-tert-ブチル-4-メトキシフェノールとの混合物）、鉱物油、脂肪酸及び脂肪酸エステルがあげられる。
- 15 毒餌の基材としては、例えば穀物粉、植物油、糖、結晶セルロース等の餌成分が挙げられる。毒餌には必要に応じて、ジブチルヒドロキシトルエン、ノルジヒドログアイアレチン酸等の酸化防止剤、デヒドロ酢酸等の保存料、トウガラシ粉末等の誤食防止剤、チーズ香料、タマネギ香料、ピーナッツオイル等の害虫誘引性香料等が添加される。

20

- 本発明の有害節足動物防除剤は、有害節足動物に直接及び／又は有害節足動物の生息場所（巣、植物体、土壌等）に施用することにより用いられる。栽培植物に寄生する有害節足動物を防除する場合は、例えば、本発明の有害節足動物防除剤を該栽培植物の地上部に散布する、本発明の有害節足動物防除剤を該栽培植物
25 の株本に灌注する等により行われる。

本発明の有害節足動物防除剤を農林業分野の有害節足動物防除に用いる場合、その施用量は、1000m²あたりの本発明化合物の量で通常0.1～10000gである。本発明の有害節足動物防除剤が乳剤、フロアブル剤、水和剤、マイクロカプセル剤等に製剤化されている場合は、本発明化合物濃度が通常10～10

0 0 0 p p mとなるように水で希釈して散布することにより施用する。本発明の有害節足動物防除剤が油剤、粒剤、粉剤等に製剤化されている場合は、通常そのまま施用する。

- 5 本発明の有害節足動物防除剤を防疫分野の有害節足動物の防除に用いる場合、その施用量は面上に処理するときは適用面積 1 m^2 あたりの本発明化合物量で通常 $0.001 \sim 100 \text{ mg}$ であり、空間に処理するときは適用空間 1 m^3 あたりの本発明化合物量で通常 $0.001 \sim 10 \text{ mg}$ である。本発明の有害節足動物防除剤が乳剤、フロアブル剤、水和剤、マイクロカプセル剤等に製剤化されている場合は本発明化合物濃度が通常 $0.01 \sim 100000 \text{ p p m}$ となるように水で希
- 10 釈して施用する。本発明の有害節足動物防除剤が油剤、エアゾール、燻煙剤、毒餌等に製剤化されている場合は通常そのまま施用する。

- また、本発明の有害節足動物防除剤は他の殺虫剤、殺線虫剤、殺ダニ剤、殺菌剤、除草剤、植物生長調節剤、共力剤、肥料、土壌改良剤、動物用飼料等と共に
- 15 用いることもできる。

かかる殺虫剤、殺ダニ剤及び殺線虫剤としては、

- 例えばフェニトロチオン、フェンチオン、ピリダフェンチオン、ダイアジノン、クロルピリホス、クロルピリホスメチル、アセフェート、メチダチオン、ジスルホトン、DDVP、スルプロホス、プロフェノホス、シアノホス、ジオキサベン
- 20 ゾホス、ジメトエート、フェントエート、馬拉チオン、トリクロロホン、アジンホスメチル、モノクロトホス、ジクロトホス、エチオン、ホスチアゼート等の有機リン系化合物、

- BPMC、ベンフラカルブ、プロポキスル、カルボスルファン、カルバリル、メソミル、エチオフェンカルブ、アルジカルブ、オキサミル、フェノチオカルブ、
- 25 チオジカルブ等のカーバメート系化合物、

エトフェンプロックス、フェンバレレート、エスフェンバレレート、フェンプロパトリン、シペルメトリン、 α -シペルメトリン、 Z -シペルメトリン、ペルメトリン、シハロトリン、 λ -シハロトリン、シフルトリン、 β -シフルトリン、デルタメトリン、シクロプロスリン、 ϵ -フルバリネート、フルシトリネート、

ピフェンスリン、アクリナスリン、トラロメスリン、シラフルオフェン、ハルフェンプロクス等のピレスロイド化合物、
アセタミプリド、チアメトキサム、チアクロプリド等のネオニコチノイド化合物、
クロルフルアズロン、テフルベンズロン、フルフェノクスロン、ルフェニュロン等のベンゾイルフェニルウレア系化合物、
5 テブフェノジド、ハロフェノジド、
メトキシフェノジド、クロマフェノジド等のベンゾイルヒドラジド化合物、ブプロフェジン等のチアジジン誘導体、カルタップ、チオシクラム、ベンスルタップ等のネライストキシン誘導体、エンドスルファン、 γ -BHC、1, 1-ビス(クロロフェニル)-2, 2, 2-トリクロロエタノール等の塩素化炭化水素化合物、
10 アミトラズ、クロルジメホルム等のホルムアミジン誘導体、ジアフェンチウロン等のチオ尿素誘導体、エチプロール、アセトプロール等のフェニルピラゾール系化合物、クロルフェナピル、ピメトロジン、スピノサド、インドキサカルブ、プロモプロピレート、テトラジホン、キノメチオネート、プロパルゲイト、フェンブタティンオキシド、ヘキシチアゾクス、エトキサゾール、クロフェンテジン、
15 ピリダベン、ピリダリル、フェンピロキシメート、テブフェンピラド、ピリミジフェン、フェナザキン、アセキノシル、ピフェナゼート、フルアクリピリム、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、ミルベメクチン、アヴェエルメクチン、エマメクチン安息香酸塩、アザジラクチン、ポリナクチンコンプレックス〔テトラナクチン、ジナクチン、トリナクチン〕等があげられる。

20

以下、本発明を製造例、製剤例および試験例等によりさらに詳しく説明するが、本発明はこれらの例に限定されるものではない。なお、製造例中、 $^1\text{H-NMR}$ のデータは、重クロロホルム中、テトラメチルシランを内部標準として測定したものである。

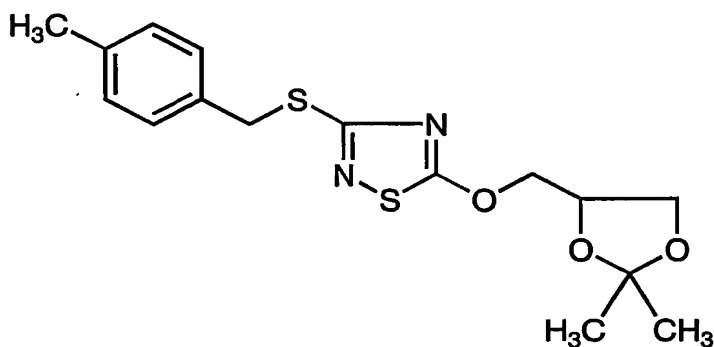
25 本発明化合物の製造法につき、製造例を示す。

製造例 1

N, N-ジメチルホルムアミド 2 g に 5-クロロ-3-(4-メチルベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾール 0. 257 g 及び 2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキソラン-4-メタノール 0. 145 g を溶解し、約 0℃ で水素化ナトリ

ウム（60%油性）48mgを加え、約0℃で30分間、室温で4時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して5-（2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル）メトキシ-3-（4-メチルベンジル）チオ-1,2,4-チアジアゾール0.27gを得た。

5-（2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル）メトキシ-3-（4-メチルベンジル）チオ-1,2,4-チアジアゾール（以下、本発明化合物1と記す。）

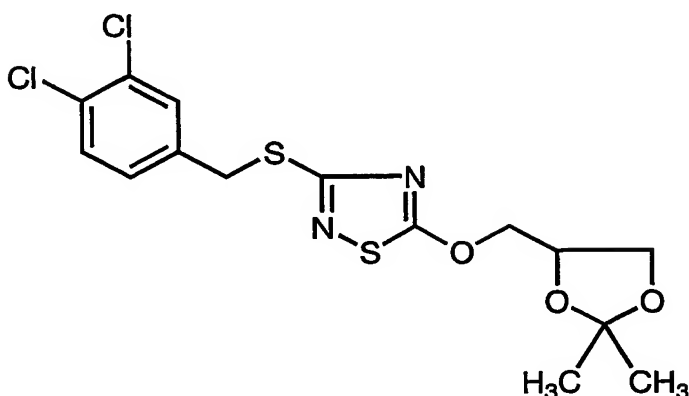


$^1\text{H-NMR}$: 7.29 (d, 2H) 7.11 (d, 2H) 4.54-4.44 (m, 3H) 4.37 (d, 2H) 4.15-4.11 (m, 1H) 3.83-3.80 (m, 1H) 2.32 (s, 3H) 1.45 (s, 3H) 1.38 (s, 3H)

製造例2

N,N-ジメチルホルムアミド2gに後記参考製造例8により製造した5-クロロ-3-（3,4-ジクロロベンジル）チオ-1,2,4-チアジアゾールの粗生成物312mg及び2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-メタノール0.145gを溶解し、約0℃で水素化ナトリウム（60%油性）48mgを加え約0℃で30分間、室温で4時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して5-（2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル）メトキシ-3-（3,4-ジクロロベンジル）チオ-1,2,4-チアジアゾール120mgを得た。

5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(3,4-ジクロロベンジル)チオ-1,2,4-チアジアゾール(以下、本発明化合物2と記す。)

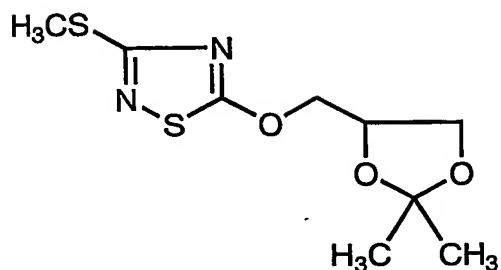


5 $^1\text{H-NMR}$: 7.55 (s, 1H) 7.36 (d, 1H) 7.26-7.22 (m, 1H) 4.55-4.44 (m, 3H) 4.31 (s, 2H) 4.15-4.09 (m, 1H) 3.84-3.80 (m, 1H) 1.45 (s, 3H) 1.38 (s, 3H)

製造例3

10 N,N-ジメチルホルムアミド40mlに後記参考製造例1により製造した5-クロロ-3-メチルチオ-1,2,4-チアジアゾール3.34g及び2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-メタノール2.90gを溶解し、約0℃で水素化ナトリウム(60%油性)880mgを加え、同温で1時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで
15 抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-メチルチオ-1,2,4-チアジアゾール4.67gを得た。

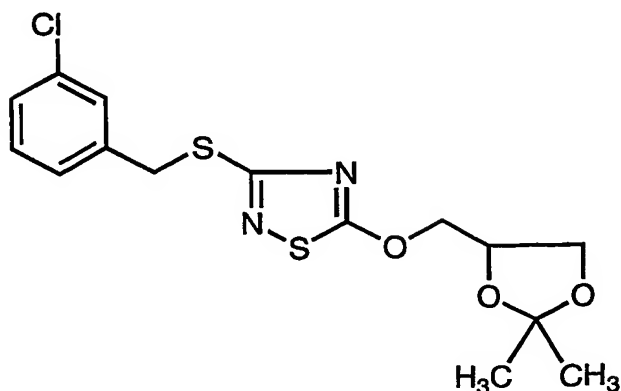
5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-メチルチオ-1,2,4-チアジアゾール(以下、本発明化合物3と記す。)
20



$^1\text{H-NMR}$: 4.57–4.46 (m, 3H) 4.16–4.09 (m, 1H)
 3.85–3.81 (m, 1H) 2.60 (s, 3H) 1.45 (s, 3H)
 1.35 (s, 3H)

5 製造例 4

- N, N-ジメチルホルムアミド 2 ml に後記参考製造例 6 により製造した 5-クロロ-3-(3-クロロベンジル)チオ-1,2,4-チアジアゾールの粗生成物 300 mg 及び 2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-メタノール 157 mg を溶解し、水素化ナトリウム (60%油性) 52 mg を加え室温で 2 時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して 5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(3-クロロベンジル)チオ-1,2,4-チアジアゾール 150 mg を得た。
- 15 5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(3-クロロベンジル)チオ-1,2,4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 4 と記す。)

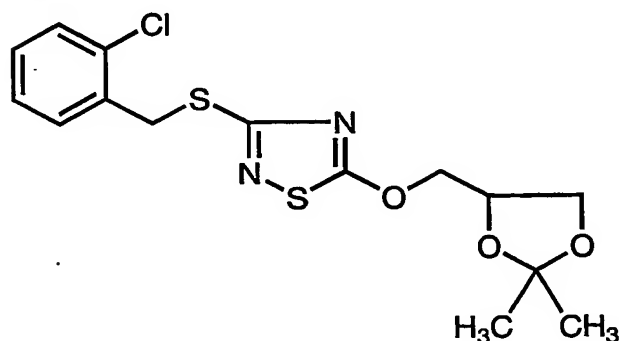


$^1\text{H-NMR}$: 7.42 (s, 1H) 7.31–7.22 (m, 2H) 4.5

4-4.45 (m, 3H) 4.35 (s, 2H) 4.16-4.11 (m, 1H) 3.85-3.81 (m, 1H) 1.45 (s, 3H) 1.38 (s, 3H)

製造例 5

- 5 N, N-ジメチルホルムアミド 2 ml に後記参考製造例 5 により製造した 5-クロロ-3-(2-クロロベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾールの粗生成物 300 mg 及び 2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-メタノール 157 mg を溶解し、水素化ナトリウム (60%油性) 52 mg を加え室温で 2 時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して 5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(2-クロロベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾール 140 mg を得た。
- 10 5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(2-クロロベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 5 と記す。)



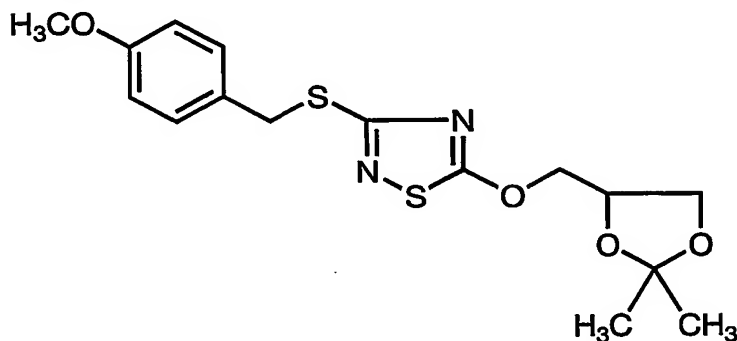
- 1H-NMR: 7.56 (m, 1H) 7.37 (m, 1H) 7.20 (m, 2H) 4.56-4.45 (m, 5H) 4.15-4.11 (m, 1H) 3.84-3.80 (m, 1H) 1.45 (s, 3H) 1.38 (s, 3H)
- 20

製造例 6

N, N-ジメチルホルムアミド 2 ml に後記参考製造例 4 により製造した 5-クロロ-3-(4-メトキシベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾール 200 mg 及び 2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-メタノール 153 mg

gを溶解し、約0℃で水素化ナトリウム（60%油性）35mgを加え、約0℃で15分間、室温で2時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して5-（2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル）メトキシ-3-（4-メトキシベンジル）チオ-1,2,4-チアジアゾール200mgを得た。

5-（2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル）メトキシ-3-（4-メトキシベンジル）チオ-1,2,4-チアジアゾール（以下、本発明化合物6と記す。）



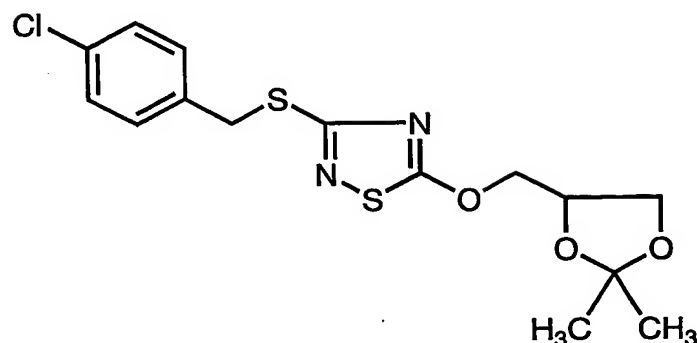
$^1\text{H-NMR}$: 7.33 (d, 2H) 6.84 (d, 2H) 4.54-4.46 (m, 3H) 4.36 (s, 2H) 4.15-4.13 (m, 1H) 3.84-3.79 (m, 4H) 1.45 (s, 3H) 1.38 (s, 3H)

製造例7

N,N-ジメチルホルムアミド3mlに後記参考製造例3により製造した5-クロロ-3-（4-クロロベンジル）チオ-1,2,4-チアジアゾールの粗成生物416mg及び2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-メタノール198mgを溶解し、約0℃で水素化ナトリウム（60%油性）72mgを加え、同温で約1時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して5-（2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル）メトキシ-3-（4-クロロベンジル）チオ-1,2,4-チアジアゾール460mgを得た。

5-（2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル）メトキシ-3-（4

ークロロベンジル) チオー 1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 7 と記す。)

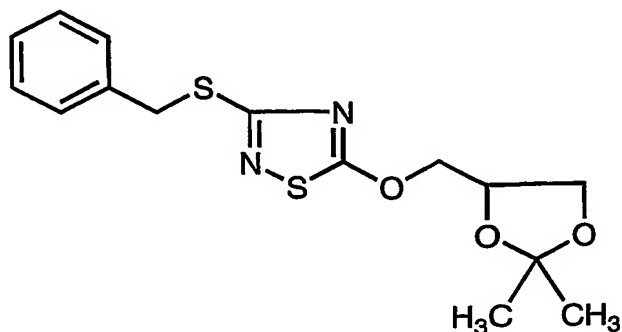


$^1\text{H-NMR}$: 7.36 (d, 2H) 7.27 (d, 2H) 4.55-4.44 (m, 2H) 4.35 (s, 2H) 4.17-4.10 (m, 1H) 3.84-3.81 (s, 1H) 1.47 (s, 3H) 1.38 (s, 3H)

製造例 8

N, N-ジメチルホルムアミド 5 ml に後記参考製造例 2 により製造した 5-クロロ-3-ベンジルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 340 mg 及び 2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-メタノール 222 mg を溶解し、約 0℃ で水素化ナトリウム (60%油性) 84 mg を加えた後、室温で約 1 時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して 5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル) メトキシ-3-ベンジルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 370 mg を得た。

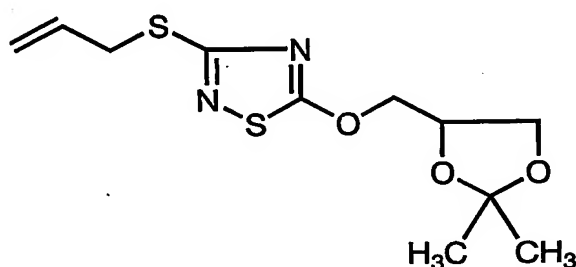
5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル) メトキシ-3-ベンジルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 8 と記す。)



$^1\text{H-NMR}$: 7.42 (d, 2H) 7.34–7.24 (m, 3H) 4.55–4.43 (m, 3H) 4.40 (s, 2H) 4.15–4.12 (m, 1H) 3.84–3.81 (m, 1H) 1.45 (s, 3H) 1.35 (s, 3H)

5 製造例 9

- N, N-ジメチルホルムアミド 4 g に後記参考製造例 10 により製造した 5-クロロ-3-アリルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 386 mg 及び 2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-メタノール 277 mg を溶解し、氷冷下で水素化ナトリウム (60%油性) 88 mg を加えた。氷冷下で 1 時間攪拌した後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して 5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル) メトキシ-3-アリルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 530 mg を得た。
- 5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル) メトキシ-3-アリルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 9 と記す。)



- $^1\text{H-NMR}$: 5.96 (m, 1H) 5.32 (d, 1H) 5.15 (d, 1H) 4.51 (m, 3H) 4.13 (m, 1H) 3.84 (m, 3H) 1.45 (s, 3H) 1.36 (s, 3H)

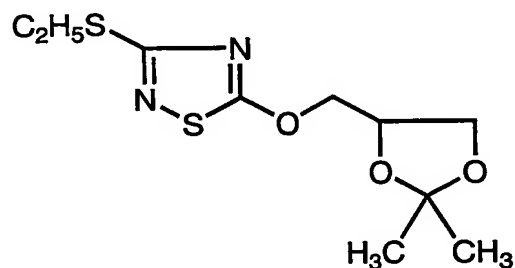
製造例 10

- N, N-ジメチルホルムアミド 4 ml に後記参考製造例 7 により製造した 5-クロロ-3-エチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 362 mg 及び 2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-メタノール 264 mg を溶解し、約 0℃ で水素化ナトリウム (60%油性) 88 mg を加え、同温で 30 分攪拌した。そ

の後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、*tert*-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキソラン-4-イル) メトキシ-3-エチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール

5 410mgを得た。

5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキソラン-4-イル) メトキシ-3-エチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合物10と記す。)



¹H-NMR: 4.51 (m, 3H) 4.14 (m, 1H) 3.84 (m, 1H) 3.17 (q, 2H) 1.41 (m, 9H)

10

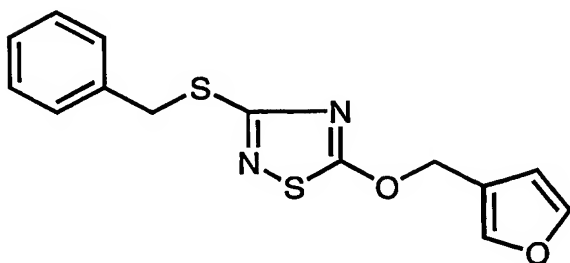
製造例11

N,N-ジメチルホルムアミド2gに5-クロロ-3-ベンジルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール0.243g及び3-フランメタノール0.098gを溶解し、約0℃で水素化ナトリウム(60%油性)0.045gを加え、約0℃で1

15 時間、さらに室温で2時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、*tert*-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して、5-(3-フリル) メトキシ-3-ベンジルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール0.17gを得た。

5-(3-フリル) メトキシ-3-ベンジルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール

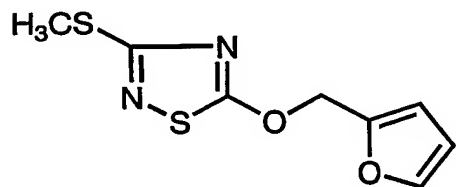
20 (以下、本発明化合物11と記す。)



$^1\text{H-NMR}$: 7.56 (s, 1H) 7.42 (m, 3H) 7.30 (m, 3H) 6.50 (s, 1H) 5.37 (s, 2H) 4.41 (s, 2H)

製造例 12

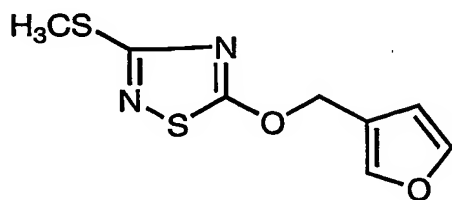
N, N-ジメチルホルムアミド 4ml に 5-クロロ-3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 0.334g 及び 2-フランメタノール 0.196g を溶解し、約 0℃ で水素化ナトリウム (60%油性) 0.084g を加え、約 0℃ で 0.5 時間、さらに室温で 4 時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して、5-(2-フリル)メトキシ-3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 0.25g を得た。
5-(2-フリル)メトキシ-3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 12 と記す。)



$^1\text{H-NMR}$: 7.47 (m, 1H) 6.56 (m, 1H) 6.40 (m, 1H) 5.45 (s, 2H) 2.62 (s, 3H)

製造例 13

2-フランメタノールの代わりに 3-フランメタノール 0.196g を用いた以外は製造例 12 と同様にして 5-(3-フリル)メトキシ-3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 390mg を得た。
5-(3-フリル)メトキシ-3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 13 と記す。)



$^1\text{H-NMR}$: 7.58 (s, 1H) 7.43 (d, 1H) 6.51 (d, 1

H) 5.38 (s, 2H) 2.62 (s, 3H)

製造例 14

2-フランメタノールの代わりにテトラヒドロ-3-フランメタノール 204 mg を用いた以外は製造例 12 と同様にして 5-(テトラヒドロ-3-フリル)

5 メトキシ-3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 406 mg を得た。

5-(テトラヒドロ-3-フリル) メトキシ-3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 14 と記す。)



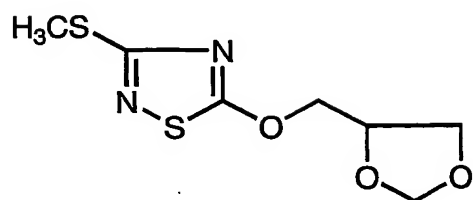
$^1\text{H-NMR}$: 4.49-4.36 (m, 2H) 3.93-3.65 (m, 4H)

10 2.84-2.74 (m, 1H) 2.60 (s, 3H) 2.17-2.05 (m, 1H) 1.76-1.65 (m, 1H)

製造例 15

N, N-ジメチルホルムアミド 10 ml に 3-メチルチオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール 835 mg 及びグリセロールホルマール 520 mg を溶
15 解し、約 0℃ で水素化ナトリウム (60% 油性) 204 mg を加え、約 0℃ で 20 分間、室温で 30 分間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に加え、t-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 20 : 1)、次いで分取 HPLC に付して 5-(1, 3-ジオキサラン-4-イル) メトキシ-3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 250 mg
20 を得た。

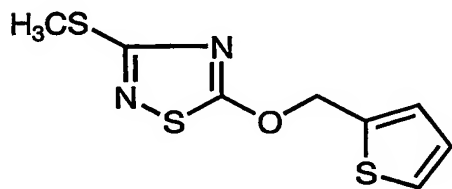
5-(1, 3-ジオキサラン-4-イル) メトキシ-3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 15 と記す。)



$^1\text{H-NMR}$: 5.08 (s, 1H) 4.93 (s, 1H) 4.55–4.45 (m, 3H) 4.06–4.02 (m, 1H) 3.82–3.78 (m, 1H) 2.60 (s, 3H)

5 製造例 16

N,N-ジメチルホルムアミド 4 ml に 5-クロロ-3-メチルチオ-1,2,4-チアジアゾール 0.334 g 及び 2-チオフエンメタノール 228 mg を溶解し、約 0℃ で水素化ナトリウム (60%油性) 0.084 g を加え、約 0℃ で 0.5 時間、さらに室温で 4 時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して、5-(2-チエニル)メトキシ-3-メチルチオ-1,2,4-チアジアゾール 66 mg を得た。
5-(2-チエニル)メトキシ-3-メチルチオ-1,2,4-チアジアゾール
(以下、本発明化合物 16 と記す。)

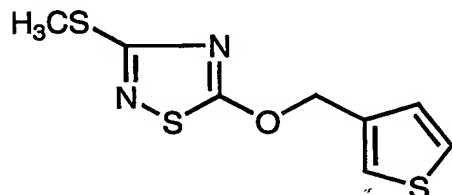


$^1\text{H-NMR}$: 7.38 (d, 1H) 7.25 (d, 1H) 7.22 (m, 1H) 5.65 (s, 2H) 2.62 (s, 3H)

製造例 17

N,N-ジメチルホルムアミド 4 ml に 5-クロロ-3-メチルチオ-1,2,4-チアジアゾール 0.334 g 及び 3-チオフエンメタノール 228 mg を溶解し、約 0℃ で水素化ナトリウム (60%油性) 0.084 g を加え、約 0℃ で 0.5 時間、さらに室温で 4 時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を濃縮して得られ

た残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して、5-(3-チエニル)メトキシ-3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール500mgを得た。
5-(3-チエニル)メトキシ-3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール
(以下、本発明化合物17と記す。)

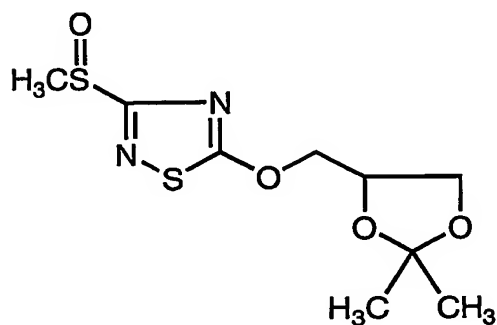


$^1\text{H-NMR}$: 7.43 (m, 1H) 7.35 (m, 1H) 7.17 (m, 1H) 5.49 (s, 2H) 2.61 (s, 3H)

製造例18

(1) クロホルム90mlに5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-メチルチオ-1,2,4-チアジアゾール4.67gを溶解し、約0℃で3-クロロ過安息香酸(純度70%)3.92gを少量ずつに分けて徐々に加え攪拌した。その後、反応混合物を飽和亜硫酸ナトリウム水溶液に注加し、クロホルムで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して、5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-メタンスルフィニル-1,2,4-チアジアゾール3.87gを得た。

5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-メタンスルフィニル-1,2,4-チアジアゾール

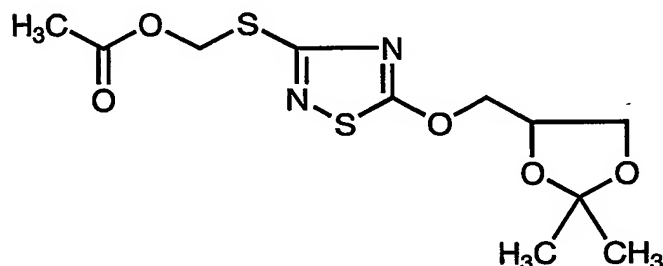


$^1\text{H-NMR}$: 4.67-4.49 (m, 3H) 4.18-4.14 (m, 1H)

3. 86 – 3. 32 (m, 1H) 2. 30 (s, 3H) 1. 46 (s, 3H)
1. 39 (s, 3H)

(2) 5 – (2, 2 – ジメチル – 1, 3 – ジオキソラン – 4 – イル) メトキシ –
3 – メタンスルフィニル 1, 2, 4 – チアジアゾール 3. 87 g に約 0℃ で 2,
5 6 – ルチジン 2. 97 g、無水酢酸 11. 3 g 及び トリフルオロ酢酸 無水物 4.
38 g を加えて混合し、室温で 3 日間放置した。その後、反応混合物を減圧下濃
縮してから、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加した。これを *tert* – ブチ
ルメチルエーテルで抽出した。有機層を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカ
ラムクロマトグラフィーに付し、5 – (2, 2 – ジメチル – 1, 3 – ジオキソラン
10 – 4 – イル) メトキシ – 3 – (アセチルオキシメチル) チオ – 1, 2, 4 – チア
ジアゾール 0. 18 g を得た。

5 – (2, 2 – ジメチル – 1, 3 – ジオキソラン – 4 – イル) メトキシ – 3 – (ア
セチルオキシメチル) チオ – 1, 2, 4 – チアジアゾール (以下、本発明化合物
18 と記す。)



¹H-NMR : 5. 75 (s, 2H) 4. 57 – 4. 47 (m, 3H) 4. 1
7 – 4. 13 (m, 1H) 3. 85 – 3. 82 (m, 1H) 2. 11 (s,
3H) 1. 45 (s, 3H) 1. 39 (s, 3H)

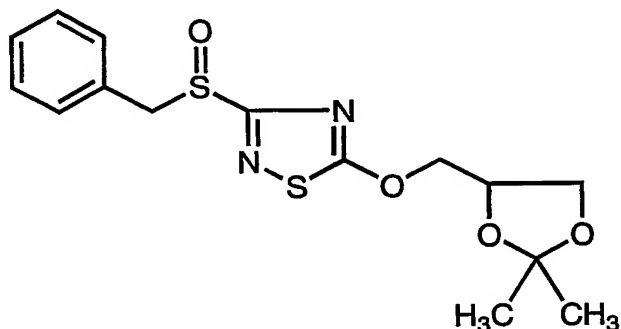
製造例 19

20 (1) クロホルム 4 ml に 5 – (2, 2 – ジメチル – 1, 3 – ジオキソラン – 4
– イル) メトキシ – 3 – ペンジルチオ – 1, 2, 4 – チアジアゾール 370 mg
を溶解し、氷冷下で 3 – クロロ過安息香酸 (純度 70%) 269 mg を少量ずつ
に分けて徐々に加え攪拌した。その後、反応混合物を飽和亜硫酸ナトリウム水溶
液に注加し、クロホルムで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、
25 飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣を

シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して、5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル) メトキシ-3-フェニルスルフィニル-1, 2, 4-チアジアゾール 360mgを得た。

5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル) メトキシ-3-フェ

5 エニルスルフィニル-1, 2, 4-チアジアゾール



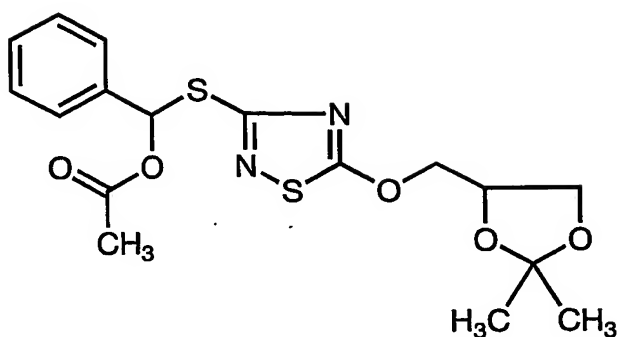
$^1\text{H-NMR}$: 7.33-7.19 (m, 5H) 4.66-4.48 (m, 3H)
4.42 (d, 1H) 4.34 (d, 1H) 4.18-4.14 (m, 1H)
3.86-3.82 (m, 1H) 1.47 (s, 3H) 1.40 (s, 3H)

10 (2) 5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル) メトキシ-3-フェニルスルフィニル-1, 2, 4-チアジアゾール 80g に約 0℃ で酢酸ナトリウム 100mg、無水酢酸 2ml を加えて混合し、14 時間加熱還流した。その後、反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加した。これを *tert*-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を濃縮して得られた残渣をシリカ

15 ゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル) メトキシ-3-(α -アセチルオキシベンジル) チオ-1, 2, 4-チアジアゾール 28mg を得た。

5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル) メトキシ-3-(α -アセチルオキシベンジル) チオ-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明

20 化合物 19 と記す。)

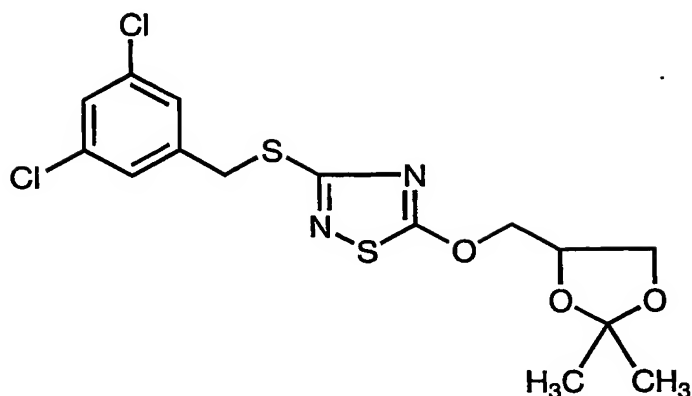


$^1\text{H-NMR}$: 7.74–7.73 (m, 1H) 7.53–7.51 (m, 2H)
 7.41–7.35 (m, 3H) 4.58–4.32 (m, 3H) 4.20
 –4.07 (m, 1H) 3.86–3.73 (m, 1H) 2.10 (s, 3
 5 H) 1.46 (s, 3H) 1.39 (s, 3H)

製造例 20

N, N-ジメチルホルムアミド 3 g に後記参考製造例 11 により製造した 5-
 クロロ-3-(3, 5-ジクロロベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾールの
 粗成生物 468 mg と 2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-メタノ
 10 ール 198 mg とを溶解し、ここに約 0℃ で水素化ナトリウム (60% 油性)
 42 mg を加え、30 分間攪拌した。その後、反応混合物に t-ブチルメチルエ
 ーテル及び飽和食塩水を加え、分液した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し
 た後、濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィーに付し 5-(2, 2-
 ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(3, 5-ジクロ
 15 ロベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾール 72 mg を得た。

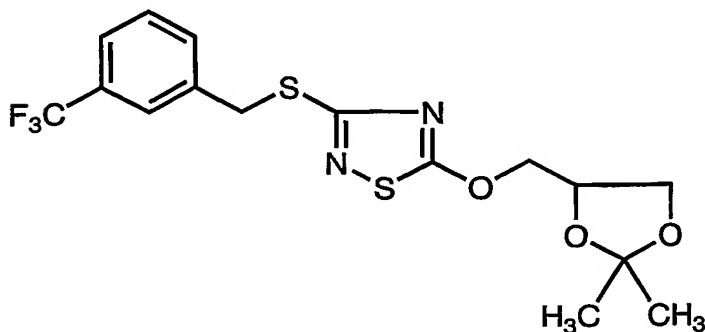
5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(3,
 5-ジクロロベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合
 物 20 と記す。)



$^1\text{H-NMR}$: 7.32 (s, 2H) 7.24 (s, 1H) 4.54–4.43 (m, 3H) 4.30 (s, 2H) 4.15–4.11 (m, 1H) 3.84–3.81 (m, 1H) 1.48 (s, 3H) 1.41 (s, 3H)

5 製造例 21

- N, N-ジメチルホルムアミド 2 g に後記参考製造例 12 により製造した 5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキソラン-4-イル)メトキシ-3-(3-(トリフルオロメチルベンジル)チオ-1,2,4-チアジアゾール)の 300 mg と 2,2-ジメチル-1,3-ジオキソラン-4-メタノール 127 mg とを溶解し、約 0℃ で水素化ナトリウム (60% 油性) 42 mg を加え、約 0℃ で 30 分間、室温で 2 時間攪拌した。その後、反応混合物に t-ブチルメチルエーテル及び飽和食塩水を加え、分液した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィーに付し 5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキソラン-4-イル)メトキシ-3-(3-(トリフルオロメチルベンジル)チオ-1,2,4-チアジアゾール) 370 mg を得た。
- 5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキソラン-4-イル)メトキシ-3-(3-(トリフルオロメチルベンジル)チオ-1,2,4-チアジアゾール) (以下、本発明化合物 21 と記す。)



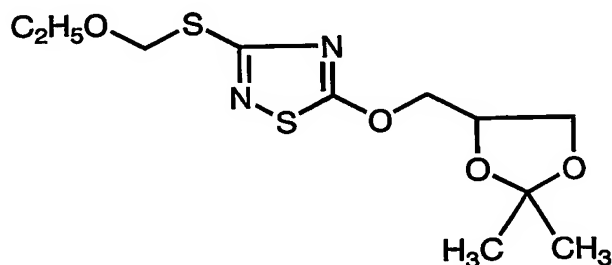
$^1\text{H-NMR}$: 7.69 (s, 1H) 7.61 (d, 1H) 7.50 (d, 1H)
7.42 (t, 1H) 4.55–4.42 (m, 5H) 4.15–4.11 (m,
1H) 3.84–3.81 (m, 1H) 1.45 (s, 3H) 1.38 (s, 3H)

5 製造例 22

N, N-ジメチルホルムアミド 3 g に 5-クロロ-3-エトキシメチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 300 mg と 2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-メタノール 188 mg とを溶解し、約 0℃ で水素化ナトリウム (60% 油性) 62 mg を加え、約 0℃ で 30 分間攪拌した後、室温で約 1 日間静置した。

10 その後、反応混合物に t-ブチルメチルエーテル及び飽和食塩水を加え、分液した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィーに付し、5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル) メトキシ-3-エトキシメチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 330 mg を得た。

15 5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル) メトキシ-3-エトキシメチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 22 と記す。)



$^1\text{H-NMR}$: 5.39 (s, 2H) 4.58–4.47 (m, 3H) 4.16–
20 4.11 (m, 1H) 3.86–3.82 (m, 1H) 3.68–3.63 (q, 2H) 1.45 (s, 3H) 1.39 (s, 3H) 1.23 (t, 3H)

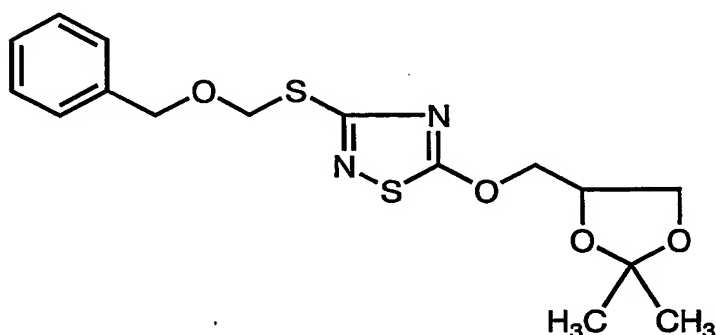
製造例 23

N, N-ジメチルホルムアミド 3 g に 5-クロロ-3-ベンジルオキシメチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 350 mg と 2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-メタノール 169 mg とを溶解し、約 0℃ で水素化ナトリウム

25

(60%油性) 56mgを加え、同温で2時間攪拌した。その後、反応混合物に
 t-ブチルメチルエーテル及び飽和食塩水を加え、分液した。有機層を無水硫酸
 ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィーに付し
 5 5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-ベン
 ジルオキシメチルチオ-1,2,4-チアジアゾール330mgを得た。

5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-ベン
 ジルオキシメチルチオ-1,2,4-チアジアゾール (以下、本発明化合物2
 3と記す。)



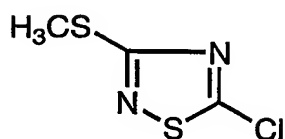
10 $^1\text{H-NMR}$: 7.36-7.28 (m, 5H) 5.41 (s, 2H) 4.69 (s, 2H) 4.57-4.46 (m, 3H) 4.16-4.11 (m, 1H) 3.85-3.82 (m, 1H) 1.45 (s, 3H) 1.39 (s, 3H)

次に、本発明化合物の製造中間体である5-クロロ-1,2,4-チアジアゾール化合物の製造につき、参考製造例として示す。

15 参考製造例1

水100mlにメチルイソチオ尿素硫酸塩18.7g、パークロロメチルメル
 カプタン25g、ドデシル硫酸ナトリウム0.15gを加え、約0℃で水酸化ナ
 トリウム21gを水100mlに溶解した溶液を約4時間かけて滴下した。滴下
 終了後、同温で2時間攪拌した。その後、反応混合物にt-ブチルメチルエー
 20 テルを加え抽出した。有機層を濃縮し、得られた残渣を減圧蒸留、次いでシリカゲ
 ルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:酢酸エチル=25:1) に付し3-メ
 チルチオ-5-クロロ-1,2,4-チアジアゾール7.64gを得た。

3-メチルチオ-5-クロロ-1,2,4-チアジアゾール

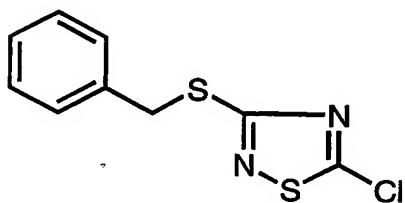


$^1\text{H-NMR}$: 2.66 (s, 3H)

参考製造例 2

トルエン 20 ml 及び水 10 ml の混合物にベンジルイソチオ尿素塩酸塩 2.02 g、パークロロメチルメルカプタン 1.86 g 及びベンジルトリエチルアンモニウムクロライド 46 mg を加え、約 0℃ で水酸化ナトリウム 1.6 g を水 10 ml に溶解した溶液を滴下し、2 時間攪拌した。その後、反応混合物に t-ブチルメチルエーテルを加え、抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 20 : 1）に付し、3-ベンジルチオ-5-クロロ-1,2,4-チアジアゾール 900 mg を得た。

3-ベンジルチオ-5-クロロ-1,2,4-チアジアゾール

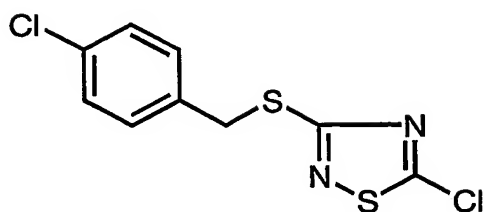


$^1\text{H-NMR}$: 7.60–7.20 (m, 5H) 4.45 (s, 2H)

15 参考製造例 3

トルエン 80 ml 及び水 40 ml の混合物に 4-クロロベンジルイソチオ尿素塩酸塩 10.0 g、パークロロメチルメルカプタン 7.85 g 及びベンジルトリエチルアンモニウムクロライド 192 mg を加え、約 0℃ で水酸化ナトリウム 6.75 g を水 40 ml に溶解した溶液を 3 時間かけて滴下した。その後、反応混合物に t-ブチルメチルエーテルを加え、抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、3-(4-クロロベンジル)チオ-5-クロロ-1,2,4-チアジアゾール 5.38 g を得た。

3-(4-クロロベンジル)チオ-5-クロロ-1,2,4-チアジアゾール

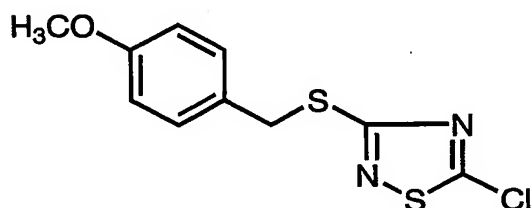


$^1\text{H-NMR}$: 7.37 (d, 2H) 7.27 (d, 2H) 4.40 (s, 2H)

参考製造例 4

トルエン 20 ml 及び水 10 ml の混合物に 4-メトキシベンジルイソチオ尿素塩酸塩 2.53 g、パークロロメチルメルカプタン 2.03 g 及びベンジルトリエチルアンモニウムクロライド 50 mg を加え、約 0℃ で水酸化ナトリウム 1.74 g を水 10 ml に溶解した溶液を 4 時間かけて滴下した。滴下終了後、さらに室温で 1 時間攪拌した。その後、反応混合物に t-ブチルメチルエーテルを加え、抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、3-(4-メトキシベンジル)チオ-5-クロロ-1,2,4-チアジアゾール 5.38 g を得た。

3-(4-メトキシベンジル)チオ-5-クロロ-1,2,4-チアジアゾール



$^1\text{H-NMR}$: 7.35 (d, 2H) 6.85 (d, 2H) 4.41 (s, 2H)

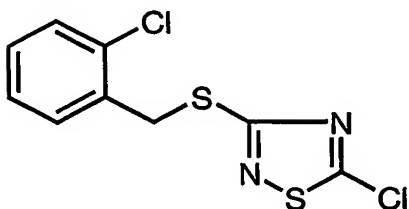
3.79 (s, 3H)

参考製造例 5

トルエン 80 ml 及び水 40 ml の混合物に 2-クロロベンジルイソチオ尿素塩酸塩 10.0 g、パークロロメチルメルカプタン 7.85 g 及びベンジルトリエチルアンモニウムクロライド 192 mg を加え、約 0℃ で水酸化ナトリウム 5.27 g を水 40 ml に溶解した溶液を 1 時間かけて滴下した。その後、反応混合物に t-ブチルメチルエーテルを加え、抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し 3-(2-クロロベンジル)チオ-5-クロロ-1,2,4-チアジアゾール 0.78 g

を得た。

3-(2-クロロベンジル)チオ-5-クロロ-1,2,4-チアジアゾール



$^1\text{H-NMR}$: 7.55 (d, 1H) 7.49 (d, 1H) 7.22 (m, 2H)

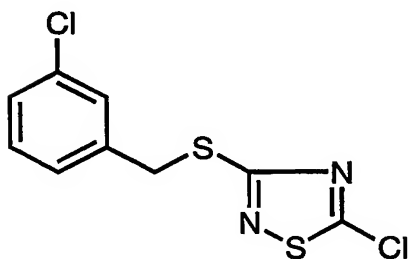
5 4.57 (s, 2H)

参考製造例 6

トルエン 80 ml 及び水 40 ml の混合物に 3-クロロベンジルイソチオ尿素塩酸塩 10.0 g、パークロロメチルメルカプタン 7.85 g 及びベンジルトリエチルアンモニウムクロライド 192 mg を加え、約 0℃ で水酸化ナトリウム 5.

10 27 g を水 40 ml に溶解した溶液を 1 時間かけて滴下した。その後、反応混合物に *t*-ブチルメチルエーテルを加え、抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し 3-(3-クロロベンジル)チオ-5-クロロ-1,2,4-チアジアゾール 1.30 g を得た。

15 3-(3-クロロベンジル)チオ-5-クロロ-1,2,4-チアジアゾール



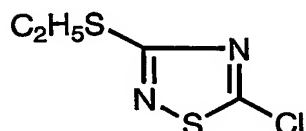
$^1\text{H-NMR}$: 7.43 (s, 1H) 7.31-7.22 (m, 3H) 4.41 (s, 2H)

参考製造例 7

20 水 60 ml にエチルイソチオ尿素臭化水素塩 10.3 g、パークロロメチルメルカプタン 10.4 g を加え、約 0℃ で水酸化ナトリウム 9.39 g を水 60 ml に溶解した溶液をゆっくり滴下した。その後、反応混合物に *t*-ブチルメチル

エーテルを加え、抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝30：1）に付し、3-エチルチオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール2.54gを得た。

5 3-エチルチオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール

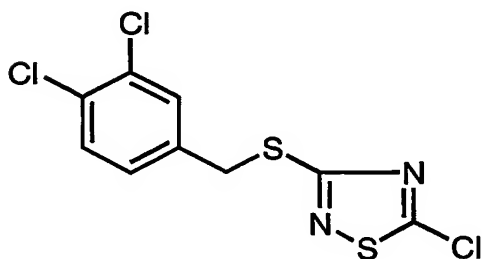


$^1\text{H-NMR}$: 3.22 (q, 2H) 1.44 (t, 3H)

参考製造例 8

水50mlに3, 4-ジクロロベンジルイソチオ尿素塩酸塩12.9g及びパークロロメチルメルカプタン8.82gを加え、約0℃で水酸化ナトリウム7.58gを水50mlに溶解した溶液を徐々に滴下し、4時間攪拌した。その後、反応混合物にt-ブチルメチルエーテルを加え、抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーにより、3-(3, 4-ジクロロベンジル)チオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール3.1gを粗生成物として得た。

3-(3, 4-ジクロロベンジル)チオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール

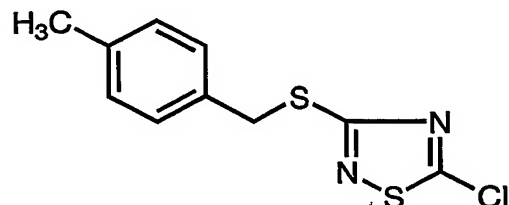


参考製造例 9

20 水50mlに4-メチルベンジルイソチオ尿素塩酸塩9.46g及びパークロロメチルメルカプタン8.11gを加え、約0℃で水酸化ナトリウム6.98gを水50mlに溶解した溶液を滴下し4時間攪拌した。その後、反応混合物にt-ブチルメチルエーテルを加え、抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥

し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、3-(4-メチルベンジル)チオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール3.6 gを粗生成物として得た。

3-(4-メチルベンジル)チオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール



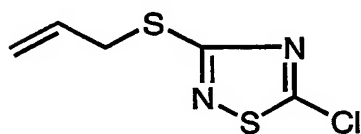
5

参考製造例 10

水50 ml にアリルイソチオ尿素塩酸塩9.33 g 及びパークロロメチルメルカプタン8.82 g を加え、約0℃で水酸化ナトリウム7.58 g を水50 ml を溶解した溶液を滴下し、4時間攪拌した。その後、反応混合物にt-ブチルメチルエーテルを加え、抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、3-アリルチオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール3.6 g を得た。

10

3-アリルチオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール



$^1\text{H-NMR}$: 6.03-5.83 (m, 1H) 5.34 (d, 1H) 5.19 (d, 1H) 3.88 (d, 1H)

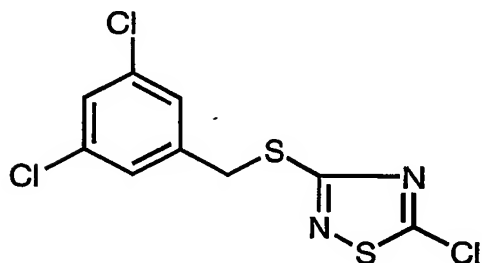
15

参考製造例 11

水25 ml 及びジクロロメタン25 ml の混合物に3, 5-ジクロロベンジルイソチオ尿素塩酸塩8.95 g 及びパークロロメチルメルカプタン6.12 g を加え、約0℃で水酸化ナトリウム5.26 g を水50 ml 溶解した溶液を約3時間かけて滴下した。滴下終了後、さらに室温で1時間攪拌した。その後、反応混合物にクロロホルムを加え抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=30:1)により、3-(3, 5-ジクロロベンジル)チオ-5-クロロ-1, 2,

20

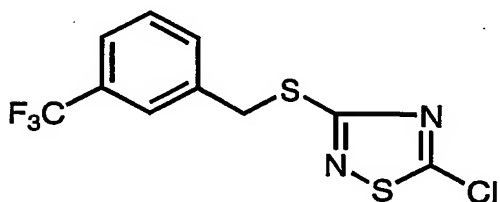
4-チアジアゾールの祖生成物 2. 4 g を得た。



参考製造例 1 2

水 25 ml 及びジクロロメタン 50 ml の混合物に 3-トリフルオロメチルベンジルイソチオ尿素塩酸塩 12.0 g 及びパークロロメチルメルカプタン 8.24 g を加え、約 0℃ で水酸化ナトリウム 7.09 g を水 25 ml を溶解した溶液を約 1.5 時間かけて滴下した。滴下終了後、さらに室温で 2 時間攪拌した。その後、反応混合物にクロロホルムを加え抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 20 : 1）に付し、3-（3-トリフルオロメチルベンジル）チオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール 5.9 g を得た。

3-（3-トリフルオロメチルベンジル）-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール



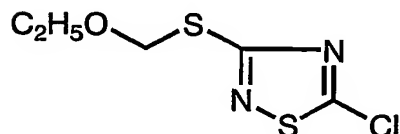
¹H-NMR : 7.69 (s, 1H) 7.61 (d, 1H) 7.52 (d, 1H) 7.44 (t, 1H) 4.47 (s, 2H)

参考製造例 1 3

水 35 ml 及びジクロロメタン 70 ml の混合物にエトキシメチルイソチオ尿素塩酸塩 12.2 g 及びパークロロメチルメルカプタン 13.2 g を加え、約 0℃ で水酸化ナトリウム 11.4 g を水 35 ml に溶解した溶液を約 1.5 時間かけて滴下した。滴下終了後、さらに室温で 1 時間攪拌した。その後、反応混合物にクロロホルムを加え抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して

得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し 3-エトキシメチルチオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール 5.22 g を得た。

3-エトキシメチルチオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール

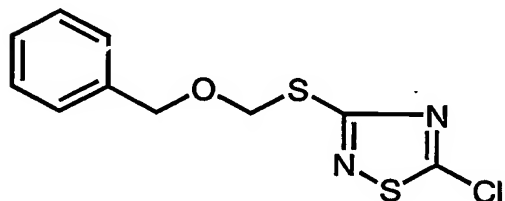


5 $^1\text{H-NMR}$: 5.43 (s, 2H) 3.68 (q, 2H) 1.26 (t, 3H)

参考製造例 14

水 25 ml 及びジクロロメタン 50 ml にベンジルオキシメチルイソチオ尿素塩酸塩 11.3 及びパークロロメチルメルカプタン 9.02 g を加え、約 0℃ で水酸化ナトリウム 7.76 g を水 25 ml に溶解した溶液を約 1.5 時間かけて滴下した。滴下終了後、さらに室温で 1 時間攪拌した。その後、反応混合物にクロロホルムを加え抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し 3-ベンジルオキシメチルチオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール 3.51 g を得た。

3-ベンジルオキシメチルチオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール



15 $^1\text{H-NMR}$: 7.36-7.28 (m, 5H) 5.45 (s, 2H) 4.69 (s, 2H)

次に、製剤例を示す。なお、部は重量部を表す。

製剤例 1

20 本発明化合物 1~23 の各々 9 部を、キシレン 37.5 部および N, N-ジメチルホルムアミド 37.5 部に溶解し、これにポリオキシエチレンステリルフェニルエーテル 10 部およびドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 6 部を加え、よく攪拌混合して各々の乳剤を得る。

製剤例 2

本発明化合物 1～23 の各々 9 部を、ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 20 部および珪素土 65 部を混合した中に加え、よく攪拌混合して各々の水和剤を得る。

製剤例 3

- 5 本発明化合物 1～23 の各々 3 部、合成含水酸化珪素微粉末 5 部、ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム 5 部、ベントナイト 30 部およびクレー 57 部を加え、よく攪拌混合し、ついでこれらの混合物に適量の水を加え、さらに攪拌し、増粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

製剤例 4

- 10 本発明化合物 1～23 の各々 4.5 部、合成含水酸化珪素微粉末 1 部、凝集剤としてドリレス B（三共社製）1 部、クレー 7 部を乳鉢でよく混合した後にジュースミキサーで攪拌混合する。得られた混合物にカットクレー 86.5 部を加えて、充分攪拌混合し各々の粉剤を得る。

製剤例 5

- 15 本発明化合物 1～23 の各々 10 部、ポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩 50 部を含むホワイトカーボン 35 部及び水 55 部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎することにより各々の製剤を得る。

製剤例 6

- 20 本発明化合物 1～23 の各々 0.5 部をジクロロメタン 10 部に溶解し、これをアイソパー M（イソパラフィン：エクソン化学登録商標名）89.5 部に混合して油剤を得る。

製剤例 7

- 25 本発明化合物 1～23 の各々の 0.1 部、ネオチオゾール（中央化成株式会社）49.9 部をエアゾール缶に入れ、エアゾールバルブを装着した後、25 部のジメチルエーテル及び 25 部の LPG を充填し、振とうを加え、アクチュエータを装着することにより油性エアゾールを得る。

製剤例 8

本発明化合物 1～23 の各々の 0.6 部、BHT 0.01 部、キシレン 5 部、脱臭灯油 3.39 部および乳化剤 {アトモス 300（アトモスケミカル社登録商

標名) } 1部を混合溶解したものと、蒸留水50部とをエアゾール容器に充填し、バルブ部分を取り付け、該バルブを通じて噴射剤(LPG)40部を加圧充填して、水性エアゾールを得る。

続いて、本発明化合物が有害節足動物防除剤の有効成分として有用であること

5 を試験例により示す。

試験例

前記製剤例5により得られた供試化合物の製剤を有効成分濃度が500ppmとなるように水で希釈して、試験用薬液を調製した。

10 一方、ポリエチレンカップにキュウリを植え、第1本葉が展開するまで生育させ、そこにワタアブラムシ約20頭を寄生させた。1日後、そのキュウリに上記の試験用薬液を20ml／カップの割合で散布した。散布6日後に生存しているワタアブラムシの数を調査した。

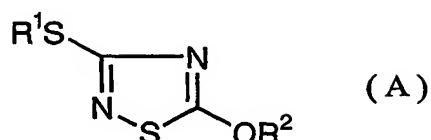
その結果、本発明化合物1～9、11、13～15、17～23の処理区は各々生存していたワタアブラムシは3頭以下であったが、無処理区では20頭以上で
15 あった。

産業上の利用可能性

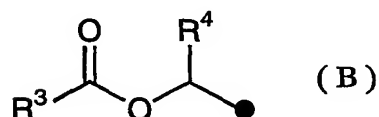
本発明化合物を用いることにより、有害節足動物を防除することができる。

請求の範囲

1. 式 (A)



- C 1 - C 7 アルキル基、C 3 - C 7 アルケニル基、C 3 - C 7 アルキニル基、C
 5 2 - C 7 アルコキシアルキル基、C 2 - C 7 アルキルチオアルキル基、C 4 - C
 7 アルコキシアルコキシアルキル基、C 4 - C 7 アルキルチオアルコキシアルキ
 ル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフェニル基で置
 換された C 1 - C 2 アルキル基、置換されていてもよいフェニルオキシ基で置換
 された C 1 - C 2 アルキル基、置換されていてもよいフェニル基で置換された C
 10 2 - C 3 アルコキシアルキル基、又は式 (B)



- {式中、R³ は C 1 - C 3 アルキル基を表し、R⁴ は水素原子、メチル基、エチル
 基、プロピル基又は置換されていてもよいフェニル基を表す。} を表し、
 R² は置換されていてもよい複素環基（但し、該複素環は異項原子として酸素原
 15 子または硫黄原子のみを有す 5 員の環。）で置換された C 1 - C 4 アルキル基を表
 し、を表す。]

で示されるチアジアゾール化合物。

2. 式 (A) において、R¹ が C 1 - C 7 アルキル基である請求項 1 に記載の
 チアジアゾール化合物。

- 20 3. 式 (A) において、R¹ が C 3 - C 7 アルケニル基、C 2 - C 7 アルコキ
 シアルキル基、C 2 - C 7 アルキルチオアルキル基、C 4 - C 7 アルコキシアル
 コキシアルキル基又は C 4 - C 7 アルキルチオアルコキシアルキル基である請求
 項 1 ~ 5 のいずれかに記載のチアジアゾール化合物。

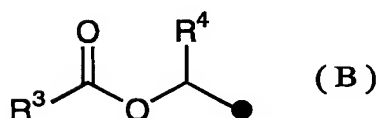
4. 式 (A) において、R¹ が下記の置換基群 A より選ばれる 1 種以上で置換
 25 されていてもよいフェニル基、下記の置換基群 A より選ばれる 1 種以上で置換さ

れていてもよいフェニル基で置換された C 1 - C 2 アルキル基、下記の置換基群 A より選ばれる 1 種以上で置換されていてもよいフェニルオキシ基で置換された C 1 - C 2 アルキル基又は下記の置換基群 A より選ばれる 1 種以上で置換されていてもよいフェニル基で置換された C 2 - C 3 アルコキシアルキル基である請求項 1 に記載のチアジアゾール化合物。

置換基群 A

C 1 - C 4 アルキル基、C 1 - C 4 ハロアルキル基、C 1 - C 4 アルコキシ基、C 1 - C 4 アルキルチオ基、C 1 - C 4 ハロアルコキシ基、ニトロ基、シアノ基及びハロゲン原子。

10 5. 式 (A) において、R¹が式 (B)



15 [式中、R³はC 1 - C 3 アルキル基を表し、R⁴は水素原子、メチル基、エチル基、又は、C 1 - C 4 アルキル基、C 1 - C 4 ハロアルキル基、C 1 - C 4 アルコキシ基、C 1 - C 4 アルキルチオ基、C 1 - C 4 ハロアルコキシ基、ニトロ基、シアノ基及びハロゲン原子からなる群より選ばれる 1 種以上で置換されていてもよいフェニル基を表す。]

で示される基である請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載のチアジアゾール化合物。

20 6. 式 (A) において、R¹が下記の置換基群 A より選ばれる 1 種以上で置換されていてもよいフェニル基、下記の置換基群 A より選ばれる 1 種以上で置換されていてもよいペンジル基、下記の置換基群 A より選ばれる 1 種以上で置換されていてもよいフェニルオキシメチル基又は下記の置換基群 A より選ばれる 1 種以上で置換されていてもよいペンジルオキシメチル基である請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載のチアジアゾール化合物。

置換基群 A

25 C 1 - C 4 アルキル基、C 1 - C 4 ハロアルキル基、C 1 - C 4 アルコキシ基、C 1 - C 4 アルキルチオ基、C 1 - C 4 ハロアルコキシ基、ニトロ基、シアノ基及びハロゲン原子。

7. 式 (A) において、 R^2 が下記の置換基群Bから選ばれる1種以上で置換されてもよい複素環基（但し、該複素環は異項原子として酸素原子または硫黄原子のみを有す5員の環。）で置換されたC1-C4アルキル基である、請求項1に記載のチアジアゾール化合物。

5 置換基群B

C1-C4アルキル基、ハロゲン原子、トリフルオロメチル基、ホルミル基、およびニトロ基。

8. 式 (A) において、 R^2 が下記の置換基群Bから選ばれる1種以上で置換されてもよい複素環基（但し、該複素環は異項原子として酸素原子のみを有す5員の環。）で置換されたC1-C4アルキル基である、請求項1に記載のチアジアゾール化合物。

置換基群B

C1-C4アルキル基、ハロゲン原子、トリフルオロメチル基、ホルミル基、およびニトロ基。

15 9. 有効量の請求項1に記載のチアジアゾール化合物を含有する有害節足動物防除組成物。

10. 有効量の請求項1に記載のチアジアゾール化合物を有害節足動物又は有害節足動物の生息場所に施用する有害節足動物の防除方法。

20 11. 請求項1に記載のチアジアゾール化合物の有害節足動物防除組成物の有効成分としての使用。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP03/12831

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
Int.Cl⁷ C07D417/12, A01N43/836

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
Int.Cl⁷ C07D417/12, A01N43/836

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched
Jitsuyo Shinan Koho 1926-1996 Jitsuyo Shinan Toroku Koho 1996-2003
Kokai Jitsuyo Shinan Koho 1971-2003 Toroku Jitsuyo Shinan Koho 1994-2003

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CAPLUS/REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	DE 3030661 A1 (Bayer AG.), 01 April, 1982 (01.04.82), Page 35, 5), 6) (Family: none)	1-11
A	JP 06-329649 A (Bayer AG.), 29 November, 1994 (29.11.94), Page 28; example 10 & EP 623604 A2 & DE 4341066 A1 & AU 9459379 A & BR 9401670 A & CN 1095067 A & HU 71699 T	1-11
A	WO 92/16527 A1 (Nippon Soda Co., Ltd.), 01 October, 1992 (01.10.92), Claim 1 & AU 9214223 A & JP 04-506571 A & CN 1065268 A	1-11

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:
 "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
 "E" earlier document but published on or after the international filing date
 "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
 "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
 "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed
 "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
 "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
 "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
 "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
16 December, 2003 (16.12.03)

Date of mailing of the international search report
13 January, 2004 (13.01.04)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP03/12831

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P,A	WO 03/59897 A1 (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 24 July, 2003 (24.07.03), Full text & JP 2003-277372 A	1-11

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/12831

With respect to clearness

•Claim 1

The definition of R¹ in claim 1 is unclear.

•Claims 3 and 5

Claims 3 and 5 include the statement "the thiadiazole compound as claimed in any one of claims 1 to 5 wherein" Since the claims on which claim 3 or 5 depends include claim 3 or 5 itself, the contents meant by the statement are unclear.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07D417/12, A01N43/836

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07D417/12, A01N43/836

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報	1926-1996年
日本国公開実用新案公報	1971-2003年
日本国実用新案登録公報	1996-2003年
日本国登録実用新案公報	1994-2003年

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAPLUS/REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	DE 3030661 A1 (Bayer AG) 1982.04.01 第39頁5)、6)参照 (ファミリーなし)	1-11
A	JP 06-329649 A (バイエル・アクチエンゲゼルシャフト) 1994.11.29 第28頁実施例10参照 & EP 623604 A2 & DE 4341066 A1 & AU 9459379 A & BR 9401670 A & CN 1095067 A & HU 71699 T	1-11

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)
「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献
「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

16.12.03

国際調査報告の発送日

13.01.04

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)
郵便番号100-8915
東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)
富永 保



4C 3039

電話番号 03-3581-1101 内線 3452

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	WO 92/16527 A1 (日本曹達株式会社) 1992. 10. 01 請求項 1 参照 & AU 9214223 A & JP 04-506571 A & CN 1065268 A	1-11
P, A	WO 03/59897 A1 (住友化学工業株式会社) 2003. 07. 24 全文 & JP 2003-277372 A	1-11

明確性について

○請求項 1

請求項 1 の記載では、 R^1 の定義が不明確である。

○請求項 3, 5

請求項 3, 5 では、「～である請求項 1～5 のいずれかに記載のチアジアゾール化合物」とあるが、請求項 3 あるいは 5 自身を含んでおり、該規定の意味する内容が不明確である。